

**WO02067918**

Publication Title:

NOVEL DIALLYLMETHYLAMINE DERIVATIVE

Abstract:

A diabetes remedy, preventive for diabetic chronic complications, or antiobestic agent, characterized by containing as the active ingredient a compound represented by the general formula (I): (I) (wherein Ar represents optionally substituted aryl, etc.; R<1> represents optionally substituted C1-10 alkyl, etc.; R<2> represents hydrogen, etc.; R<3> represents optionally substituted C1-10 alkyl, etc.; R<4> represents hydrogen, etc.; R<5> represents hydrogen, etc.; R<6> represents an optionally substituted, 5- or 6-membered, heterocyclic group, etc.; and W represents a single bond, etc.) or a medically acceptable salt or ester of the compound.

-----  
Data supplied from the esp@cenet database - <http://ep.espacenet.com>

**BEST AVAILABLE COPY**

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2002 年 9 月 6 日 (06.09.2002)

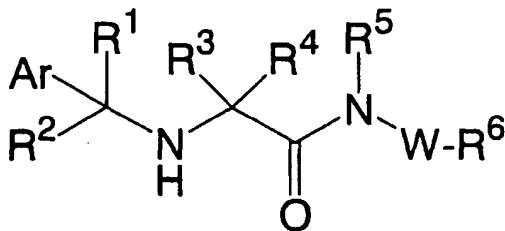
PCT

(10) 国際公開番号  
WO 02/067918 A1

- (51) 国際特許分類: A61K 31/165, 31/167, 31/18, 31/341, 31/381, 31/4035, 31/405, 31/4168, 31/4184, 31/426, 31/427, 31/428, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/445, 31/4453, 31/451, 31/47, 31/472, 31/495, 31/497, 31/5375, A61P 3/04, 3/10, 43/00, C07C 237/20, 311/05, 311/51, C07D 209/08, 209/20, 211/16, 211/46, 211/58, 211/62, 213/38, 213/40, 213/42, 213/56, 213/61, 213/74, 213/75, 215/08, 217/06, 217/24, 233/88, 235/30, 277/82, 295/18, 307/52, 333/20, 401/12, 403/12, 405/12, 409/06, 409/12, 417/12, 471/04
- (74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.); 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/01810
- (22) 国際出願日: 2002 年 2 月 27 日 (27.02.2002)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ: 特願2001-52974 2001 年 2 月 27 日 (27.02.2001) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).
- (71) 出願人 および
- (72) 発明者: 西村 輝之 (NISHIMURA, Teruyuki) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 長瀬 敏雄 (NAGASE, Toshio) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 永木 淳一 (EIKI, Jun-ichi) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).
- 添付公開書類:  
— 国際調査報告書  
— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL DIALLYLMETHYLAMINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規なジアリルメチルアミン誘導体



(I)

(57) Abstract: A diabetes remedy, preventive for diabetic chronic complications, or antiobestic agent, characterized by containing as the active ingredient a compound represented by the general formula (I): (I) (wherein Ar represents optionally substituted aryl, etc.; R<sup>1</sup> represents optionally substituted C<sub>1-10</sub> alkyl, etc.; R<sup>2</sup> represents hydrogen, etc.; R<sup>3</sup> represents optionally substituted C<sub>1-10</sub> alkyl, etc.; R<sup>4</sup> represents hydrogen, etc.; R<sup>5</sup> represents hydrogen, etc.; R<sup>6</sup> represents an optionally substituted, 5- or 6-membered, heterocyclic group, etc.; and W represents a single bond,

etc.) or a medically acceptable salt or ester of the compound.

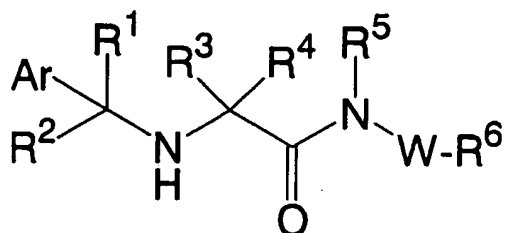
[続葉有]

WO 02/067918 A1



(57) 要約:

本発明は、一般式 (I)



[式中、Arは、置換されていてもよいアリール基等、R<sup>1</sup>は、置換されていてもよい、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキル基等、R<sup>2</sup>は、水素原子等、R<sup>3</sup>は、置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキル基等、R<sup>4</sup>は、水素原子等、R<sup>5</sup>は、水素原子等、R<sup>6</sup>は、置換されていてもよい5員もしくは6員のヘテロ環基等、Wは単結合等を示す]で表される化合物、その医薬上許容される塩若しくはエステルを有効成分として含有することを特徴とする糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤に関するものである。

# 明 細 書

新規なジアリルメチルアミン誘導体

## 5 技 術 分 野

本発明は、医薬品として有用な新規なジアリルメチルアミン誘導体の用途並びに該誘導体及びその製造法に関するものである。

## 背 景 技 術

- 10 健康人の血糖値は、インスリンの作用により、一定にコントロールされている。糖尿病とは、このコントロールが効かなくなり慢性的に高血糖状態を呈すること及びそのことによって引き起こされる疾患をいう。

- 糖尿病治療の根本は高血糖状態の是正、すなわち血中グルコース濃度を正常値に戻すことにあるが、近年では特に、空腹時血糖に影響を与えることなく、食後  
15 の急激な血糖値の上昇を如何に抑えるかという点が治療上極めて重要であると認識されてきている。

- 現在、臨床現場において使用されている主な糖尿病治療薬は、各種インスリン製剤の他に大別して以下の三種類の治療薬が存在する。第1はスルホニルウレア剤に代表されるインスリン放出薬と呼ばれる薬剤群で、この薬剤は膵臓から直接  
20 インスリン分泌を促進し血糖値を下げるものである。第2は近年上市されたインスリン抵抗性改善剤と呼ばれるもので、この薬剤は直接インスリン放出を助長することなく、末梢組織での糖の取り込みを促進することにより血糖値を下げる薬剤である。第3の $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤は、消化管における糖質の消化、吸収を遅延し、一時的な食後の血糖値の上昇を抑えることにより、血糖値の急激な  
25 上昇を制御する薬である。

一方、グルカゴン様ペプチド-1（以下、GLP-1という。）は、食事の刺激等によって、小腸腸管上皮に存在する内分泌細胞であるL細胞から分泌されるホルモンであり、膵臓ランゲルハンス島に存在する $\beta$ 細胞に作用してインスリン



分泌を促進することにより血糖を降下させることがわかっている (Eur. J. Clin. Invest、第22巻、第154頁、1992年)。GLP-1によるインスリン分泌作用は、血糖値に依存しており、正常血糖時ではGLP-1によるインスリン分泌は認められず、高血糖時にのみインスリン分泌の亢進が見  
5 られることが報告されている (Lancet、第2巻、第1300頁、1987年)。GLP-1はインスリン分泌を亢進するだけでなく、インスリンの生合成を高め (Endocrinology、第130巻、第159頁、1992年)、また、 $\beta$ 細胞の増殖を促す (Diabetologia、第42巻、第856頁、1999年) ことから、 $\beta$ 細胞の維持にとっても欠かすことの出来ない因子である。  
10

一般のII型糖尿病患者へのGLP-1投与によって血中GLP-1濃度を高値に維持した結果、高血糖状態が有意に改善されることが示されており、医療現場においてもその糖尿病に対しての有効性が確認されている (Diabetologia、第36巻、第741頁、1994年又は同、第39巻、第1546  
15 頁、1996年)

さらには、GLP-1の作用点は $\beta$ 細胞だけにとどまらず、末梢組織において糖の利用を亢進することが認められ (Endocrinology、第135巻、第2070頁、1994年又はDiabetologia、第37巻、第1163頁、1994年)、また、GLP-1の脳室内投与により摂食抑制作用を示す  
20 との報告がなされている (Digestion、第54巻、第360頁、1993年)。さらに、GLP-1投与により消化管運動抑制作用があることも報告されている (Dig. Dis. Sci.、第43巻、第1113頁、1998年)。

本発明の化合物と構造が最も近似する化合物は、特開平3-148247公報 (以下、引例Aという。)、WO98/35957 (以下、引例Bという。)、  
25 特開平5-213879 (以下、引例Cという。) 及びWO98/01417 (以下、引例Dという。) に記載されている。

しかしながら、これらの引例に記載の化合物の用途は、引例Aにおいては、コレステロール血症又はアテローム性動脈硬化症に対する医薬組成物 (明細書第18頁右下欄第12行目参照)、引例Cにおいては、気管支およびアレルギー喘息、

血小板凝集障害、敗血症性ショック、高血圧、炎症等のPAF関連疾患に対する医薬組成物（明細書第4頁、0001段落参照）、引例Dにおいては、原発性および二次性副甲状腺機能亢進症（原発性および二次性上皮小体機能亢進症）、腎性骨異栄養症、高カルシウム血症並びに骨粗鬆症に対する医薬組成物（明細書第5  
15 15頁第23行目参照）のものであり、本発明の一般式（I）の化合物に係る糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬の用途とは、全く異質の治療分野に属するものである。僅かに引例Bにおいては、肥満症、病的飢餓等の食事障害に対する医薬組成物（明細書第3頁第1行目参照）が開示され、本発明の抗肥満薬としての用途と関連するものの、引例Bの作用機序は、NPY Y5受  
10 容体拮抗物質が関与するものであるのに対し、本発明は生体内において高い血中GLP-1濃度を達成する物質が関与するものであり、この点において両者は全く異質の作用に基づくものである。

次に、各引例に記載の化合物について言及する。何れの引例に記載の化合物も、分子中にアミド結合を有する点で、本発明の一般式（I-c）の化合物と共通す  
15 15る。

しかしながら、引例Aの化合物は、一般式においてカルボニル基の結合する窒素原子が置換基Rがモノ置換したものであり、本発明の物質クレームに係る一般式（I-c）の化合物とは、カルボニル基に結合する窒素原子が水素原子を除く各種の置換基R<sup>5</sup>及びW-R<sup>6</sup>の2種の置換基が置換している点で異なる。

20 引例Bの化合物は、一般式においてカルボニル基の結合する窒素原子の置換基R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>について、水素原子、ハロゲン原子、水酸基を含め20種以上の各種の一般的な置換基を以て定義され、新規化合物及び公知化合物を包含するように広範囲記載されています。これらの置換基の中、本発明の一般式（I-c）の化合物に関係する置換基として、アリール基及びヘテロアリール基の言及がなされ  
25 25ています（明細書第5頁第11行目参照）。アリール基の具体例としては、例えばフェニル基、ナフチル基等が挙げられ、また一方、ヘテロアリール基の具体例としては、モルホリノ、ピリジル、フリル、ナフチルピリジル、キノキサリル、キノリニル、インドリジニル、ベンゾ[b]チエニル等限られた置換基が例示され、実際に実施例に支持された化合物としては、明細書第26頁の表1及び明細

書第37頁の表2に記載されたフェニル基を有する化合物のみが製造されています。

- しかしながら、本発明の一般式(I-c)の化合物は、カルボニル基の結合する窒素原子の2種の置換基の内の一方が、適宜置換基を有する、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チア
- 5 アジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基及びピロリニル基からなる群より選択される5員
- 10 若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレ
- 15 ンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基であること並びに当該2種の置換基が結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基
- 20 (但し、該脂肪族ヘテロ環基は、適宜置換基を有する、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成する点で、引例Bの化合物とは構造が相違している。
- 25 引例Cの化合物は、一般式においてカルボニル基の結合する窒素原子が他の窒素原子と共に一緒になってピペラジニル基を形成するものに限定されたものであり、本発明の一般式(I-c)の化合物とは、カルボニル基に結合する窒素原子が水素原子を除く各種の置換基 $R^5$ 及び $W-R^6$ の2種の置換基が置換している点で異なる。

引例Dの化合物において、本発明の一般式（I-c）の化合物に近似する化合物は、一般式において $[CR^1R^2]_p$ がカルボニル基を形成する場合であって、当該カルボニル基が結合する $Ar_1$ がビス（アリールメチル）アミノ基となる場合が相当し、（ビス（アリールメチル）アミノ基を有する化合物が実施例に記載

5    されている（実施例90ないし実施例121）。

しかしながら、本発明の一般式（I-c）の化合物は、引例Bの化合物との対比で示したような構造的特徴を有し、かつ当該カルボニル基の結合する窒素原子に結合する2種の置換基と形成する置換基がビス（アリールメチル）アミノ基となることはなく、引例Dの化合物とは構造的に相違する。

- 10    現在では、糖尿病治療薬として、例えばスルホニルウレア剤、インスリン抵抗性改善剤、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤等の薬剤が臨床で多く用いられているが、以下のような問題点が挙げられ、これらは十分な薬剤であるといえない。すなわち、スルホニルウレア剤は、効果の発現が遅くしかも作用持続時間が長いため、食後の高血糖時に合わせ作用を発現させるのが難しく、さらには空腹時の血糖を
- 15    降下させしめば生命にかかわるような重篤な低血糖発作を引き起こす場合もある。インスリン抵抗性改善剤は、肝臓に対する副作用がしばしば問題となっており、厳密な管理下における慎重な使用が必要となっている。また浮腫等の副作用を引き起こす場合もある。また、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤には、膨満感や下痢などの副作用が問題となっている。
- 20    したがって、昨今の糖尿病患者の増加に伴い、現在、副作用がなく、血糖値に依存して血糖値を制御できる一層有益な糖尿病治療薬の開発が臨床の現場から求められている。

## 発 明 の 開 示

- 25    本発明者らは、血糖値に依存して血糖値を制御できる糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬の創製を目的に鋭意研究を進めてきたところ、一般式（I）の化合物が生体内において高い血中GLP-1濃度を達成することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、一般式（I）のジアリールメチルアミン誘導体の用途並びに一般式

(I-c) の該誘導体及びその製造法に関するものであり、これらの発明は、文献に未記載の新規なものである。

次に本明細書中に記載された各種記号及び用語の定義について説明する。

アリール基としては、炭素数 6 ないし 15 個よりなるアリール基が好ましく、  
5 例えばナフチル基、フェニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニル基等が好ましい。

5 又は 6 員のヘテロ環基としては、例えばイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリ  
10 ダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基又はモルホリノ基等が好ましく、中でも例え  
15 ばチアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基又はモルホリノ基等が好ましく、特に例えばチアゾリル基、チエニル基、ピリジル基又はフリル基等が好ましい。

窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基としては、例えばイソ  
キノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニ  
ル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロ  
20 イソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベン  
ゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基又はメチレンジオキシフェニル基等が挙げ  
られ、中でも例えばイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル  
25 基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基又はメチレンジオキシフェニル基等が好ましく、特に例えばイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基又はメチレンジオキシフェニル基が好ましい。

ハロゲン原子とは、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を意味し、中でも例えばフッ素原子、塩素原子、ヨウ素原子等が好ましく、例えばフッ素原子、塩素原子等がより好ましい。

環状の飽和  $C_3 - C_9$  脂肪族基としては、炭素数 3 ないし 9 個よりなる環状のアルキル基等が好ましく、中でも例えば炭素数 3 ないし 6 個なる環状のアルキル基等が好適である。該環状のアルキル基としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が好ましい。

環状の不飽和  $C_3 - C_9$  脂肪族基としては、炭素数 3 ないし 9 個よりなる環状のアルケニル基等が好ましく、中でも例えば炭素数 3 ないし 6 個なる環状のアルケニル基等が好適である。該環状のアルケニル基としては、例えばシクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基、シクロノネニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等が好ましい。

アラルキル基としては、炭素数 7 ~ 15 個よりなるアラルキル基が好ましく、具体的には例えばベンジル基、 $\alpha$ -メチルベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、 $\alpha$ -メチル(1-ナフチル)メチル基、 $\alpha$ -メチル(2-ナフチル)メチル基、 $\alpha$ -エチル(1-ナフチル)メチル基、 $\alpha$ -エチル(2-ナフチル)メチル基、ジフェニルメチル基等、ジナフチルメチル基等が挙げられ、特に例えばベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、 $\alpha$ -メチルベンジル基、フェネチル基等が好ましい。

N-アラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルアミノ基、N-( $\alpha$ -メチルベンジル)アミノ基、N-フェネチルアミノ基、N-(3-フェニルプロピル)アミノ基、N-(1-ナフチルメチル)アミノ基、N-(2-ナフチルメチル)アミノ基、N-[ $\alpha$ -メチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[ $\alpha$ -メチル(2-

ナフチル) メチル] アミノ基、N- [ $\alpha$ -エチル (1-ナフチル) メチル] アミノ基、N- [ $\alpha$ -エチル (2-ナフチル) メチル] アミノ基、ジフェニルメチルアミノ基、N- (ジナフチルメチル) アミノ基等が挙げられ、特に例えばN-ベンジルアミノ基、N- ( $\alpha$ -メチルベンジル) アミノ基、N-フェネチルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-アラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジベンジルアミノ基、N, N-ジ ( $\alpha$ -メチルベンジル) アミノ基、N, N-ジフェネチルアミノ基、N, N-ジ (3-フェニルプロピル) アミノ基、N, N-ジ (1-ナフチルメチル) アミノ基、N, N-ジ (2-ナフチルメチル) アミノ基、N, N-ジ [ $\alpha$ -メチル (1-ナフチル) メチル] アミノ基、N, N-ジ [ $\alpha$ -メチル (2-ナフチル) メチル] アミノ基、N-ベンジル-N- ( $\alpha$ -メチルベンジル) アミノ基、N-ベンジル-N-フェネチルアミノ基、N-ベンジル-N- (3-フェニルプロピル) アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジベンジルアミノ基、N, N-ジ ( $\alpha$ -メチルベンジル) アミノ基、N, N-ジフェネチルアミノ基等が好ましい。

アラルキルオキシ基とは、酸素原子に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルオキシ基、 $\alpha$ -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、3-フェニルプロピルオキシ基、1-ナフチルメトキシ基、2-ナフチルメトキシ基、 $\alpha$ -メチル (1-ナフチル) メトキシ基、 $\alpha$ -メチル (2-ナフチル) メトキシ基、 $\alpha$ -エチル (1-ナフチル) メトキシ基、 $\alpha$ -エチル (2-ナフチル) メトキシ基、ジフェニルメトキシ基、ジナフチルメトキシ基等が挙げられ、特に例えばベンジルオキシ基、 $\alpha$ -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基等が好ましい。

アラルキルカルボニル基とは、カルボニル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルカルボニル基、 $\alpha$ -メチルベンジルカルボニル基、フェネチルカルボニル基、3-フェニルプロピルカルボニル基、1-ナフチルメチルカルボニル基、2-ナフチルメチルカルボニル基、 $\alpha$ -メチル (1-ナフチル) メチルカルボニル基、 $\alpha$ -メチル (2-ナフチル) メチルカルボニル基、 $\alpha$ -エチル (1-ナフチル) メチルカルボニル基、 $\alpha$ -エチル (2-ナフチル) メチルカルボニル基等が好ましい。

チル) メチルカルボニル基、ジフェニルメチルカルボニル基、ジナフチルメチルカルボニル基等が挙げられ、特に例えばベンジルカルボニル基、 $\alpha$ -メチルベンジルカルボニル基、フェネチルカルボニル基等が好ましい。

N-アラルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-( $\alpha$ -メチルベンジル)カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基、N-(3-フェニルプロピル)カルバモイル基、N-(1-ナフチルメチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルメチル)カルバモイル基、N-( $\alpha$ -メチル(1-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-( $\alpha$ -メチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-( $\alpha$ -エチル(1-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-( $\alpha$ -エチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(ジフェニルメチル)カルバモイル基、N-(ジナフチルメチル)カルバモイル基等が挙げられ、特に例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-( $\alpha$ -メチルベンジル)カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基等が好ましい。

15 N-アリーールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリーール基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルアミノ基、N-(1-ナフチル)アミノ基、N-(2-ナフチル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジアリーールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリーール基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ(1-ナフチル)アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル)アミノ基、N-フェニル-N-(1-ナフチル)アミノ基、N-フェニル-N-(2-ナフチル)アミノ基、N-(1-ナフチル)-N-(2-ナフチル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ(1-ナフチル)アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル)アミノ基等が好ましい。

アリーールオキシ基とは、酸素原子に上記のアリーール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェノキシ基等が好ましい。

アリーールスルホニル基とは、スルホニル基に上記のアリーール基が置換した基を



意味し、具体的には例えばフェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルホニル基等が好ましい。

アリールスルホニルオキシ基とは、スルホニルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルホニルオキシ基、ナフチルスルホニルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルホニルオキシ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノ基とは、アミノ基に上記のアリールスルホニル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(1-ナフチルスルホニル)アミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル)アミノ基等が好ましい。

アリールスルファモイル基とは、スルファモイル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイル基、ナフチルスルファモイル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルファモイル基等が好ましい。

アリールスルファモイルオキシ基とは、スルファモイルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイルオキシ基、ナフチルスルファモイルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルファモイルオキシ基等が好ましい。

N-アリールカルバモイル基とは、上記のアリール基がカルバモイル基にN-置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルカルバモイル基、ナフチルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルカルバモイル基等が好ましい。

アロイル基とは、カルボニル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイル基、ナフチルカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばベンゾイル基等が好ましい。

アロキシ基とは、上記のアロイル基が酸素原子に置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイルオキシ基、ナフチルカルボニルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばベンゾイルオキシ基等が好ましい。

N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のN-アロイルアミノ  $C_1-C_{10}$ アルキル基が置換した基を意味

し、具体的には例えばN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイル)アミノエチル)カルバモイル基、N-(N-ナフチルカルボニルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基等が好ましい。

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基としては、カルボニル基に炭素数1ないし5個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基、ペンタノイル基等が挙げられ、中でも例えばアセチル基、プロピオニル基、ピバロイル基等が好ましい。

N-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記のC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-アセチルアミノ基、N-プロピオニルアミノ基、N-ブチリルアミノ基、N-イソブチリルアミノ基、N-バレリルアミノ基、N-イソバレリルアミノ基、N-ピバロイルアミノ基、N-ペンタノイルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-アセチルアミノ基、N-プロピオニルアミノ基、N-ピバロイルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記のC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジブチリルアミノ基、N, N-ジイソブチリルアミノ基、N, N-ジバレリルアミノ基、N, N-ジイソバレリルアミノ基、N, N-ジピバロイルアミノ基、N, N-ジペンタノイルアミノ基、N-アセチル-N-プロピオニルアミノ基、N-アセチル-N-ブチリルアミノ基、N-アセチル-N-ピバロイルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジブチリルアミノ基、N, N-ジピバロイルアミノ基等が好ましい。

N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし6個より

なるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-sec-ブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-ペンチルアミノ基、N-ネオペンチルアミノ基、N-ヘキシルアミノ基、N-イソヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でも  
5 例えばN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし  
10 6個よりなるアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N, N-ジイソプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジtert-ブチルアミノ基、N, N-ジペンチルアミノ基、N, N-ジヘキシルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルア  
15 ミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-tert-ブチル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジイソプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジtert-ブチルア  
ミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、  
20 N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミノ基等が好ましい。

N-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数1  
ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例え  
ばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバ  
25 モイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-ペンチルカルバモイル基、N-ネオペンチルカルバモイル基、N-ヘキシルカルバモイル基、N-イソヘキシルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも

例えばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が好ましい。

- 5 N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジプロピルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルカルバモイル基、N, N-ジペンチルカルバモイル基、N, N-ジヘキシルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が好ましい。
- 10
- 15

- N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数2  
20 ないし6個よりなるアルケニル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基、N-イソプロペニルカルバモイル基、N-(2-ブテニル)カルバモイル基、N-イソブテニルカルバモイル基、N-(2-ペンテニル)カルバモイル基、N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。
- 25

N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数2ないし6個よりなるアルケニル基がN, N-二置換した基が好ましく、

具体的には例えばN, N-ジビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N, N-ジ(1-プロペニル)カルバモイル基、N, N-ジイソプロペニルカルバモイル基、N-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N-アリル-N-イソプテニルカルバモイル基、N-アリル-N-(2-ペンテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N-アリル-N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。

- 10 N-アミノC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基のアルキル部分にアミノ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-(2-アミノメチルエチル)カルバモイル基、N-アミノブチルカルバモイル基、N-(2-アミノメチルプロ
- 15 ピル)カルバモイル基、N-(2-アミノメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-アミノペンチルカルバモイル基、N-アミノヘキシルカルバモイル基、N-アミノオクチルカルバモイル基、N-アミノデシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-(2-アミノメチルエ
- 20 チル)カルバモイル基、N-(2-アミノメチルプロピル)カルバモイル基、N-(2-アミノメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-アミノオクチルカルバモイル基、N-アミノデシルカルバモイル基等が好ましい。

- N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基のアルキル部分にC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基
- 25 が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-(2-メトキシメチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシブチルカルバモイル基、N-(2-メトキシメチルプロピル)カルバモイル基、N-(2-メトキシメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシペンチルカルバ

モイル基、N-メトキシヘキシルカルバモイル基、N-メトキシオクチルカルバモイル基、N-メトキシデシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-(2-メトキシメチルエチル)カルバモイル基、N-(2-メトキシメチルプロピル)カルバモイル基、N-(2-メトキシメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシオクチルカルバモイル基、N-メトキシデシルカルバモイル基等が好ましい。

N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基のアルキル部分にC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシカルボニルブチルカルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチルプロピル)カルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシカルボニルペンチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルヘキシルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルオクチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルデシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシカルボニルメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチルエチル)カルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチルプロピル)カルバモイル基、N-(2-メトキシカルボニルメチル-2-メチルエチル)カルバモイル基、N-メトキシカルボニルオクチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルデシルカルバモイル基等が好ましい。

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基としては、硫黄原子に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基等が挙げられ、中でも例えばメ

チルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、*tert*-ブチルチオ基等が好ましい。

$N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基としては、スルファモイル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が *N*-置換した基が好ましく、具体的には例えば  
5 *N*-メチルスルファモイル基、*N*-エチルスルファモイル基、*N*-プロピルスルファモイル基、*N*-イソプロピルスルファモイル基、*N*-ブチルスルファモイル基、*N*-イソブチルスルファモイル基、*N*-*sec*-ブチルスルファモイル基、*N*-*tert*-ブチルスルファモイル基、*N*-ペンチルスルファモイル基、*N*-ネオペンチルスルファモイル基、*N*-ヘキシルスルファモイル基、*N*-イソヘキシルスルファモイル基等が挙げられ、中でも例えば  
10 *N*-メチルスルファモイル基、*N*-エチルスルファモイル基、*N*-イソプロピルスルファモイル基、*N*-*tert*-ブチルスルファモイル基等が好ましい。

$N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基としては、スルファモイル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が二置換した基が好ましく、具体的  
15 には例えば  $N, N$ -ジメチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジエチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジプロピルスルファモイル基、 $N, N$ -ジイソプロピルスルファモイル基、 $N, N$ -ジブチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジ*tert*-ブチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジペンチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジヘキシルスルファモイル基、*N*-エチル-*N*-メチルスルファモイル基、*N*-イソプロピル-*N*-メチルスルファモイル基、*N*-*tert*-ブチル-*N*-メチルスルファモイル基、*N*-エチル-*N*-イソプロピルスルファモイル基等が挙げられ、中でも  
20 例えば  $N, N$ -ジメチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジエチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジイソプロピルスルファモイル基、 $N, N$ -ジブチルスルファモイル基、 $N, N$ -ジ*tert*-ブチルスルファモイル基、*N*-エチル-*N*-メチルスルファモイル基、*N*-イソプロピル-*N*-メチルスルファモイル基、*N*-エチル-*N*-イソプロピルスルファモイル基等が好ましい。  
25

$C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基としては、スルフィニル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルス

ルフィニル基、ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、*sec*-ブチルスルフィニル基、*tert*-ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、ヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基等が挙げられ、中でも例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、*tert*-ブチルスルフィニル基等が好ましい。

$C_1-C_6$ アルキルスルホニル基としては、スルホニル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、*sec*-ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基等が挙げられ、中でも例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基等が好ましい。

$N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし6個よりなるアルキルスルホニル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メチルスルホニルアミノ基、N-エチルスルホニルアミノ基、N-プロピルスルホニルアミノ基、N-イソプロピルスルホニルアミノ基、N-ブチルスルホニルアミノ基、N-イソブチルスルホニルアミノ基、N-*sec*-ブチルスルホニルアミノ基、N-*tert*-ブチルスルホニルアミノ基、N-ペンチルスルホニルアミノ基、N-ネオペンチルスルホニルアミノ基、N-ヘキシルスルホニルアミノ基、N-イソヘキシルスルホニルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-メチルスルホニルアミノ基、N-エチルスルホニルアミノ基、N-プロピルスルホニルアミノ基、N-ブチルスルホニルアミノ基、N-*tert*-ブチルスルホニルアミノ基等が好ましい。

$C_1-C_6$ アルコキシ基としては、酸素原子に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、ヘキ



シルオキシ基、イソヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基等が好ましい。

C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基としては、カルボニル基に炭素数1ないし5  
5 個よりなるアルコキシ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ネオペンチルオキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばメトキシ  
10 カルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等が好ましい。

N–C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数3ないし6  
個なる環状のアルキル基がN-置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロピ  
15 ルアミノ基、N-シクロブチルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数3  
ないし6個なる環状のアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的  
20 は例えばN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基、N, N-ジシクロヘキシルアミノ基、N-シクロブチル–N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチル–N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロヘキシル–N-シクロプロピルアミノ基等が挙げ  
られ、中でも例えばN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチ  
25 ルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基等が好ましい。

C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基としては、酸素原子に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロポキシ基、N-シクロブトキシ基、N-シクロペンチルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロポキシ基、N-シクロペンチ

ルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が好ましい。

N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN-置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロブチルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が好ましい。

N, N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基、N, N-ジシクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロブチル-N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチル-N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロヘキシル-N-シクロプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基等が好ましい。

直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなる直鎖状のアルキル基が好ましく、中でも炭素数1ないし6個なる直鎖状のアルキル基が好適である。該アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基等が挙げられ、中でも例えばメチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基等が好ましい。

分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなる分枝状のアルキル基が好ましく、中でも炭素数1ないし6個なる分枝状のアルキル基が好適である。該アルキル基としては、例えばイソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ネオペンチル基、イソヘキシル基等が挙げられ、中でも例えばイソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基等が好ましい。

直鎖の不飽和のC<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなる直鎖状の

アルケニル基又はアルキニル基が好ましく、中でも炭素数1ないし6個なる直鎖状のアルケニル基又はアルキニル基が好適である。該アルケニル基としては、例えばビニル基、アリル基、1-プロペニル基、2-ブテニル基、2-ペンテニル基、2-ヘキセニル基、2-ヘプテニル基、2-オクテニル基等が挙げられ、中  
5 ても例えばビニル基、アリル基、1-プロペニル基等が好ましい。該アルキニル基としては、例えばエチニル基、1-プロピニル基、1-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキシニル基、1-ヘプチニル基、1-オクチニル基等が挙げられ、中でも例えばエチニル基、1-プロピニル基等が好ましい。

分枝鎖の不飽和の $C_1-C_9$ 脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなる分枝状  
10 のアルケニル基又はアルキニル基が好ましく、中でも炭素数1ないし6個なる分枝状のアルケニル基又はアルキニル基が好適である。該アルケニル基としては、例えばイソプロペニル基、イソブテニル基等が挙げられ、中でも例えばイソプロペニル基等が好ましい。該アルキニル基としては、例えばエチニル基、3-メチル-1-ペンテニル基、4-メチル-1-ヘキシニル基等が挙げられ、中でも例  
15 えば3-メチル-1-ペンテニル基等が好ましい。

飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基又は不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基とは、上記の環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和の $C_1-C_9$ 脂肪族基又は分枝鎖の不飽和の $C_1-C_9$ 脂肪族基を意味する。

$C_1-C_{10}$ アルキル基とは、炭素数1ないし10個よりなるアルキル基が好ま  
20 しく、直鎖状であっても、分枝状であってもよい。中でも炭素数1ないし6個なる直鎖状又は分枝状のアルキル基が好適である。該アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシ  
25 ル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基等が挙げられ、中でも例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ヘキシル基等が好ましい。

脂肪族ヘテロ環基としては、例えばアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基又はピペラジニル基等が好ましく、中でもピロリジニ

ル基、ピペリジニル基又はピペラジニル基等が好ましい。

- Ar は、例えばアリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基又は1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該アリール基としては、例えばフェニル基及びナフチル基からなる群より選択される置換基が好ましく、中でも例えばフェニル基が
- 5 好ましい。該5員又は6員のヘテロ環基としては、例えばイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、
- 10 ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される置換基が好ましく、中でも例えばチアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される置換基が好ましく、特に例えばチアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択
- 15 される置換基が好ましい。該1ないし3環性の複素芳香環基としては、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する複素芳香環基が好ましく、例えばイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、
- 20 ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される置換基が好ましく、中でも例えばイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソ
- 25 インドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される置換基が好ましく、特に例えばイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニ

ル基からなる群より選択される置換基が好ましい。

- なお、該アリール基、該5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基は、例えばアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基（以下、環上置換基という。）、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及びN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基

からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい。また上記の直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基は、上記の環上置換基を適宜置換することができる。

- 5 該アリール基、該5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基の置換基中、好適なものは、例えばアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、
- 10 基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、
- 15  $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基であり、中でも例えばアミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基
- 20 からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基等が挙げられ
- 25

る。

$R^1$ は、例えば $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、脂肪族ヘテロ環基、アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基又は1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該 $C_1-C_{10}$ アルキル基、  
5 該環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該脂肪族ヘテロ環基、該アリール基、該5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基等は、 $A_r$ と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も $A_r$ と同様）を有することができる。

$R^1$ 中、好適なものは、例えば直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1$   
10  $-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘ  
15 テロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、  
20 テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられ、中でも例えば直鎖の飽和 $C_1$   
 $-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
25 基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインド

リル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられる。

- 5  $R^2$ は、例えば水素原子、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基又は脂肪族ヘテロ環基、アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基若しくは1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該 $C_1-C_{10}$ アルキル基、該環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該アリール基、該脂肪族ヘテロ環基、5員若しくは6員のヘテロ環基又は
- 10 該1ないし3環性の複素芳香環基等は、 $A_r$ と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も $A_r$ と同様）を有することができる。

- $R^2$ 中、好適なものは、例えば水素原子又は直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基
- 15 からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、
- 20 イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素
- 25 原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられ、中でも水素原子又は直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で



- 置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられる。

- 10  $R^3$ は、例えば $C_1-C_{10}$ アルキル基又はアリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基若しくは1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該 $C_1-C_{10}$ アルキル基、該アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基等は、 $A_r$ と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も $A_r$ と同様）を有することができる。

- 15  $R^3$ 中、好適なものは、例えば直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられ、中でも例えば直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに分枝鎖の

- 不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい  $C_1-C_{10}$  アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が挙げられる。
- 5     $R^4$  は、例えば水素原子又は  $C_1-C_{10}$  アルキル基、アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基若しくは1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該  $C_1-C_{10}$  アルキル基、該アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基等は、 $A_r$  と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も  $A_r$  と同様）を有することができる。
- 15     $R^4$  中、例えば水素原子又は直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びに  $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$  アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、中でも例えば水素原子又は直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びに  $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ
- 25

基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等が好ましい。

$R^5$ は、例えば水素原子又は環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基若しくは飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、アリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基若しくは1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。該環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、該飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、該不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、該アリール基、該5員若しくは6員のヘテロ環基又は該1ないし3環性の複素芳香環基等は、 $A_r$ と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も $A_r$ と同様）を有することができる。

$R^5$ 中、例えば水素原子又は直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、

- アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基が好ましく、中でも例えば水素原子又は直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択
- 10 される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基等が好ましい。
- 15  $R^6$ は、例えばアリール基、5員若しくは6員のヘテロ環基若しくは1ないし3環性の複素芳香環基、又は、 $R^5$ 及び $R^5$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、上記の環上置換基置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基
- 20 及びピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい）を形成することができる。該アリール基、該5員若しくは6員のヘテロ環基、該1ないし3環性の複素芳香環基又は該脂肪族ヘテロ環基等は、 $A_r$ と同様に環上置換基（但し、好適な環上置換基も $A_r$ と同様）を有することができる。

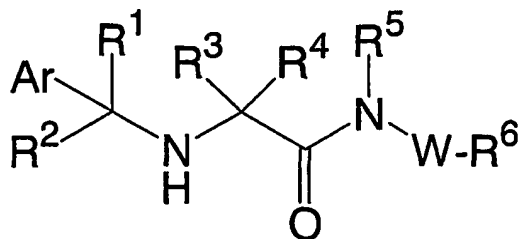
- R<sup>6</sup>中、例えば直鎖の飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、フリル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベンゾトリアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、R<sup>5a</sup>及びR<sup>5a</sup>と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N－アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N－ジ－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシ基及びC<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、

- ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成する基が好ましく、中でも例えば直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基及びピリジル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、ベンゾイミダゾリル基及びベンゾチアゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、又は、 $R^{5b}$ 及び $R^{5b}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基(但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)が好ましい。

Wは、単結合又は直鎖状若しくは分枝鎖の $C_1-C_6$ 低級アルキレン基を示し、中でも単結合が好ましい。

次に、本発明の一般式(I)の化合物について説明する。

- 25 本発明の糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤の活性成分である化合物は、一般式(I)



- [式中、Arは、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和
- 5 C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N－アラルキルアミノ基、N，N－ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N－アラルキルカルバモイル基、アリール基、N－アリールアミノ基、N，N－ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N－アリールスルホニルアミノ基、アリール
- 10 スルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N－アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N－（N－アロイルアミノ）C<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>アルカノイル基、N－C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N，N－ジ－C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N，N－ジ－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N，N－ジ－C<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N－C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N，N－ジ－C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N－アミノC<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルチオ基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、N，N－ジ－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、N－C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、N－C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、N，N－ジ－C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基、N－C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基及びN，N－ジ－C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ
- 25

- れる置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及び
- 5 ナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より
- 10 選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、
- 15 ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^1$ は、アジド基、アミノ基、
- 20 カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアリールアミノ
- 25 基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N$ -( $N$ -アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカ



- ノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N, N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ -アミノ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び  $N, N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル

- 基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^2$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-

ジーC<sub>3</sub>ーC<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基  
 並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の  
 不飽和C<sub>1</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>  
 ーC<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>ーC<sub>6</sub>アルコキシ基並びにC<sub>1</sub>ーC<sub>6</sub>アルキルアミノ基からな  
 5 る群より選択される置換基で置換されていてもよい、C<sub>1</sub>ーC<sub>10</sub>アルキル基、環  
 状の飽和C<sub>3</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、又はアジリジニル  
 基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択さ  
 れる脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるア  
 リール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾ  
 10 リル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリ  
 ジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロ  
 リル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒ  
 ドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニ  
 ル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基  
 15 若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、  
 インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル  
 基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テ  
 トラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、  
 フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾ  
 20 リル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニ  
 ル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より  
 選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素  
 芳香環基、R<sup>3</sup>は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ  
 基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニ  
 25 トロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の  
 飽和C<sub>3</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>ーC<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、Nーア  
 ラルキルアミノ基、N、Nージアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラ  
 ルキルカルボニル基、Nーアラルキルカルバモイル基、アリール基、Nーアリー  
 ルアミノ基、N、Nージアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホ

- ニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、ア  
 リールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバ  
 モイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ ア  
 ルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルア  
 5 ミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルア  
 ミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ ア  
 ルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N  
 -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_1$   
 10  $_0$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキ  
 ルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモ  
 イル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルス  
 ルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニ  
 ルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C$   
 15  $_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基  
 及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ  
 れる置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
 基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の  
 20 不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ  
 基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキ  
 ル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソ  
 オキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾ  
 リル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジ  
 25 ニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニ  
 ル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフランニル基、  
 ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリ  
 ノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノ  
 リル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、

- エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリ
- 5 アゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^4$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、
- 10 ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、
- 15 アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N,
- 20 N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N,
- 25 N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シク

- ロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基若しくはフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^5$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスル

- ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、  
 アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N,  
 N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N,  
 5 N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、  
 N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカル  
 バモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1$ -  
 $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモ  
 10 イル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N,  
 N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、  
 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C$   
 $_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロ  
 アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$   
 15 シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN,  
 N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置  
 換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直  
 鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  
 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基から  
 20 なる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和  $C_3-C_9$ 脂肪  
 族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群よ  
 り選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリ  
 ル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリア  
 ザリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラ  
 25 ザリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニ  
 ル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニ  
 ル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6  
 員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インド  
 リル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、

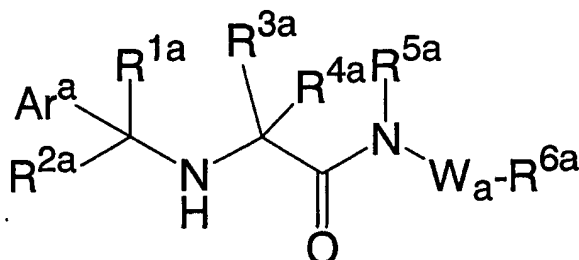
- キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは
- 5 不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^6$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキル
- 10 オキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)
- 15  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバ
- 20 モイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ ア
- 25



- ルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボ  
 ニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロア  
 ルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキ  
 ルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基から  
 5 なる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪  
 族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖  
 の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミ  
 ノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及び  
 ナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチ  
 10 アゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル  
 基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、  
 ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニ  
 ル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリ  
 ジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択  
 15 される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル  
 基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェ  
 ニル基、キノキサニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロ  
 インドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイ  
 ソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、  
 20 ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフ  
 ラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、  
 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1な  
 いし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基を示すか、又は、 $R^5$ 及び $R^5$ と結  
 合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリ  
 25 ジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族  
 ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アジド基、アミノ基、カルバモイル  
 基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、  
 スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホル  
 ミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、

- アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラ  
 ルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、ア  
 リール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキ  
 シ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスル  
 5 ホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、  
 N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- (N-アロイルア  
 ミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2$   
 - $C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N  
 - $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C$   
 10  $_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル  
 基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニル  
 カルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$   
 アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボ  
 ニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C$   
 15  $_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、  
 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C$   
 $_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ  
 カルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$   
 シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シク  
 20 ロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイ  
 ル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、  
 直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C$   
 $_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並び  
 にN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換され  
 25 ていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基  
 又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基  
 及びピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮  
 合されていてもよい) を形成し、Wは単結合又は直鎖状若しくは分枝鎖の $C_1-C$   
 $_6$ 低級アルキレン基を示す]で表される化合物、その医薬上許容される塩若しく

はエステルであり、中でも一般式 (I-a)



- [式中、Ar<sup>a</sup>は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シア  
ノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、  
5 環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、  
N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリ  
ールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N、N-ジ-C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル  
10 基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>アルキルチオ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
ルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルア  
ミノ基、N、N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基及びC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアル  
キルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されてい  
15 もよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖  
の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキ  
シ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で  
置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるア  
リール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、  
20 イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からな  
る群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、イン  
ドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキ  
ノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチ  
アゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、  
25 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1な

- いし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1a}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラキル基、 $N$ -アラキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアラキルアミノ基、アラキル
- 5 ルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C$
- 10  $_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖
- 15 の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選
- 20 択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリ
- 25 ル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2a}$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の

- 不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジ  
アラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールス  
ルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2$   
- $C_6$  アルカノイル基、N- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$   
5 アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$  アルコキシ  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、  
N- $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $C_1-C$   
 $_6$  アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$  アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$  アルコ  
キシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ  
基、N, N-ジ- $C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ基及び  $C_3-C_6$  シクロアルキル  
10 オキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよ  
い、直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽  
和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基  
並びに N- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換  
されていてもよい、 $C_1-C_{10}$  アルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状  
15 の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基  
及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及  
びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、  
ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、  
ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員の  
20 ヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル  
基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノ  
リニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフ  
ェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群  
より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の  
25 複素芳香環基、 $R^{3a}$  は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、  
ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状  
の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカ  
ルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリ  
ールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$  アルカノイル基、N

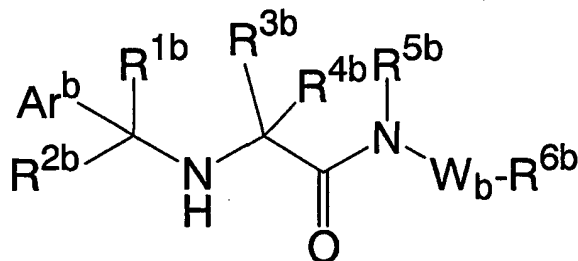
- $-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該
- 5 置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエ
- 10 ニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジ
- 15 オキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4a}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキル
- 20 オキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$
- 25 アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-$

- $C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、イ
- 5   ンドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり
- 1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5a}$ は、水素原子又はアミ
- 10   ノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、
- 15    $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環
- 20   状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒド
- 25   ロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される

- 脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6a}$ は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラールキル基、アラールキルオキシ基、アラールキルカルボニル基、アリール基、アリール
- 5 オキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝
- 10 鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チア
- 15 ゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、フリル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリ
- 20 ル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベンゾトリアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、 $R^{5a}$ 及び
- 25  $R^{5a}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラールキル基、アラールキルオキシ基、アラールキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ



- 基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基及びC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、W<sub>b</sub>は単結合又は直鎖状のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>低級アルキレン基若しくは分枝鎖のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>低級アルキレン基を示す]で表される化合物又はその医薬上許容される塩若しくはエステルが好ましく、特に一般式(I-b)



- [式中、Ar<sup>b</sup>は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基及びC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインド

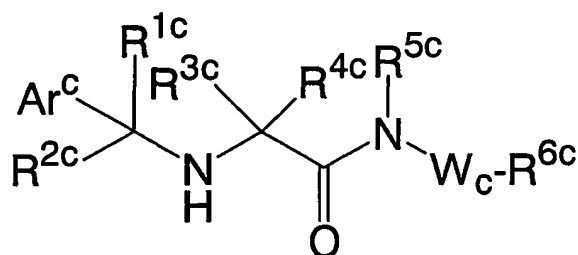
- リル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェ  
 ニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群よ  
 り選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複  
 素芳香環基、 $R^{1b}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン原  
 5 子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$   
 $C_6$ アルキルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$   
 $C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ  
 カルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される  
 置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、  
 10 直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽  
 和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ  
 基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナ  
 フチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピ  
 リジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基  
 15 若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒド  
 ロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオ  
 キシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から  
 なる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3  
 環性の複素芳香環基、 $R^{2b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボ  
 20 キシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、  
 アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルア  
 ミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$   
 $C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる  
 群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C$   
 25  $_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
 基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$   
 $C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、  
 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂  
 肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基

- からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、
- 5   ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3b}$ は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル
- 10   基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で
- 15   置換されていてもよい $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル
- 20   基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、
- 25    $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換され

- ていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{6b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6b}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基及びピリジル基からなる群より選択される

- 5 員若しくは6員のヘテロ環基、ベンゾイミダゾリル基及びベンゾチアゾリル基  
 からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、又は、 $R^{5b}$ 及び $R^{5b}$   
 $^b$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、ピロリジニル基、ピペリジニル基及  
 びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族  
 5 ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラ  
 ルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニ  
 ル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1$   
 $-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
 基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-$   
 10  $C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、  
 フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、  
 ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基か  
 らなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよ  
 い）を形成し、 $W_6$ は単結合を示す]で表される化合物又はその医薬上許容される  
 15 塩若しくはエステルが好ましい。

また、一般式（I）の化合物中、一般式（I-c）



- [式中、 $Ar^c$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、  
 カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ  
 20 基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和  
 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラル  
 キルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキ  
 ルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールア  
 ミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル  
 25 基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリール

- スルファモイル基、アリーールスルファモイルオキシ基、N-アリーールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$  アルカノイル基、N- $C_2-C_6$  アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$  アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$  アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$  アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$  アルコキシ  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$  アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$  アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$  アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$  シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$  シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$  シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリーール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロ

- インドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、
- 5 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3$
- 10  $-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファ
- 15 ャモイルオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N$ - $(N$ -アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_{10}$ アル
- 20 キルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキル
- 25 スルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアル

- キルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換
- 5 基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チア
- 10 ジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イ
- 15 ソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル
- 20 基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2c}$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲ
- 25 ン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N、N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリール



- スルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニ

- ル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テ
- 5    トラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より
- 10    芳香環基、 $R^{3c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラ
- 15    ルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ ア
- 20    ルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N
- 25    -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_10$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニ

- ルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソ
- 5 オキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリ
- 10 ノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベン
- 15 ゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4c}$ は、
- 20 水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミ

- ノ基、N、N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカル
- 5 バモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N、N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N、N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N、N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1$
- 10 - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N、N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN、N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基若しくはフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル
- 25 基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル

基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R<sup>5c</sup>は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N、N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基、N-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N、N-ジ-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N、N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N、N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N、N-ジ-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N-アミノC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、N、N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキ

- ルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-ア

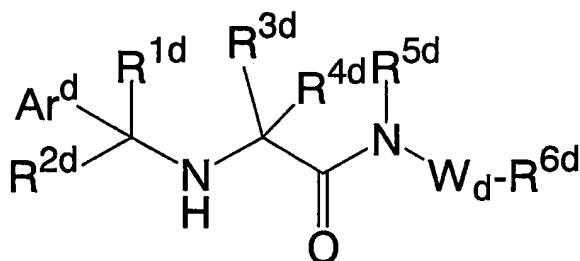
- ラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリー  
 ルアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホ  
 ニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリ  
 5   ールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバ  
 モイル基、アロイル基、アロキシ基、N- (N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ ア  
 ルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルア  
 ミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルア  
 ミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 10   バモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ ア  
 ルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N  
 -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_1$   
 $_0$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキ  
 ルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモ  
 15   イル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルス  
 ルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニ  
 ルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C$   
 $_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基  
 20   及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ  
 れる置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽  
 和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$   
 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群よ  
 り選択される置換基で置換されていてもよい、イソオキサゾリル基、イソチアゾ  
 25   リル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、  
 チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピ  
 リダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フラザニル基、イミダ  
 ザゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピ  
 ロリジニル基及びピロリニル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘ

- テロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基を示すか、又は、 $R^{5c}$ 及び $R^{5c}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及び
- 10 びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラル
- 15 キルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイ
- 20 ル基、アロイル基、アロキシ基、N-（N-アロイルアミノ） $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイ
- 25 ル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスル



- フィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニル  
 アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-$   
 $C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基  
 5 及び $N$ ,  $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ  
 れる置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
 基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の  
 不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルア  
 ミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及  
 10 びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、  
 ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より  
 選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、  
 $W_c$ は単結合を示す。但し $Ar_c$ 、 $R^{1c}$ 及び $R^{2c}$ は同時にフェニル基である場合を  
 除く]で表される化合物、その医薬上許容される塩若しくはエステルは、文献に未  
 15 記載の新規化合物である。

一般式 (I-c) の化合物中、好適なものは、一般式 (I-d)



- [式中、 $Ar^d$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シア  
 ノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、  
 20 環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ ,  
 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリ  
 ールスルホニル基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、  
 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-$   
 $C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル  
 25 基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1$

- $-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていて
- 5 もよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、
- 10 イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、
- 15 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1d}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択
- 20 される置換基並びに該置換基で置換されていてよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖
- 25

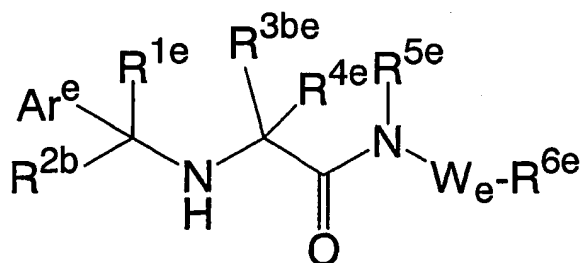
- の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びに  $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$  アルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群
- 5 より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、
- 10 テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2d}$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハ
- 15 ロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$  アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$
- 20 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$  アルコキシ  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$  アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$  アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$  シクロアルキルアミノ基及び  $C_3-C_6$  シクロアルキル
- 25 オキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びに  $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$  アルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状

- の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、
- 5 ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群
- 10 より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3d}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$  アルカノイル基、N- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$  アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$  シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該
- 20 置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$  脂肪族基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$  アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、
- 25 ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジ

- オキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4d}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和
- 5  $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、
- 10  $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アル
- 15 キルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、イ
- 20 ンドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5d}$ は、アミノ基、カルボ
- 25 キシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロ

- アルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換
- 5 基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジ
- 10 ヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロ
- 15 リジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6d}$ は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和
- 20  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、
- 25

- ピリミジニル基、ピリダジニル基及びピラゾリル基からなる群より選択される5  
 員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリ  
 ル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テト  
 ラヒドロイソキノリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベ  
 ンゾトリアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子  
 5 からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ない  
 し3環性の複素芳香環基又は、 $R^{5d}$ 及び $R^{5d}$ と結合する窒素原子と共に一緒にな  
 って、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及び  
 ピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘ  
 テロ環基は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ  
 10 基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、  
 アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、ア  
 ロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミ  
 ノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシ  
 15 カルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置  
 換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択さ  
 れるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、  
 ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘ  
 テロ環基で縮合されていてもよい）を形成し、 $W_d$ は単結合を示す。但し $Ar^d$ 、  
 20  $R^{1d}$ 及び $R^{2d}$ は同時にフェニル基である場合を除く]で表される化合物又はその  
 医薬上許容される塩若しくはエステルであり、中でも、一般式（I-e）



- [式中、 $Ar^e$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン原子、  
 ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-$   
 25  $C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$

- アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1e}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2e}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラキル基、アリールスルホニル基、



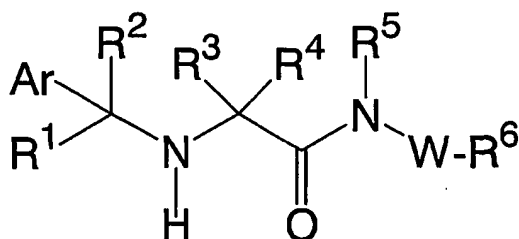
- アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3e}$ は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選

- 択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4e}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、
- 5  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換され
- 10 ていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基から
- 15 なる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5e}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の
- 20 飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及び
- 25 メチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族

- 基、 $R^{6e}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、
- 5 分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基チアゾリル基及びピリジル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはベンゾイミダゾリル基及びベンゾチアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、 $R^{6e}$ 及び $R^{5e}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、ピロリジニル基、
- 10 ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換
- 15 されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい）を形成し、 $W_e$ は単結合を示す。但し $Ar^e$ 、 $R^{1e}$ 及び $R^{2e}$ は同時にフェニル基である場合を除く]で表される化合物又はその医薬上許
- 25 容される塩若しくはエステルが好ましい。

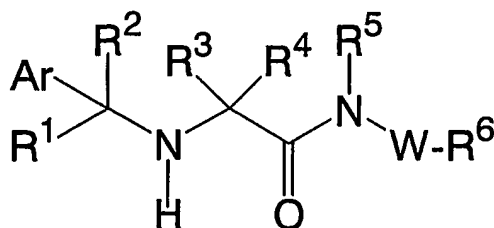
以下に、本発明の一般式(I)の化合物の代表例を表1ないし表14に示す。

(表 1)



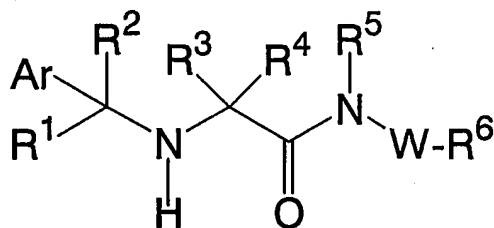
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1001	Ph	Ph	H	Me	H	Dihydroindolyl
1002	Ph	Ph	H	Et	H	Dihydroindolyl
1003	Ph	Ph	H	n-Pr	H	Dihydroindolyl
1004	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1005	Ph	Ph	H	n-Bu	H	Dihydroindolyl
1006	Ph	Ph	H	i-Bu	H	Dihydroindolyl
1007	Ph	Ph	H	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> )CH	H	Dihydroindolyl
1008	Ph	Ph	H	t-Bu	H	Dihydroindolyl
1009	Ph	Ph	H	Ph	H	Dihydroindolyl
1010	Ph	Ph	H	4-F-Ph	H	Dihydroindolyl
1011	Ph	Ph	H	4-Cl-Ph	H	Dihydroindolyl
1012	Ph	Ph	H	PhCH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1013	Ph	Ph	H	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1014	Ph	Ph	H	4-F-PhCH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1015	Ph	Ph	H	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1016	Ph	Ph	H	1-Nap-CH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1017	Ph	Ph	H	HO-Ph-CH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1018	Ph	Ph	H	HOCH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1019	Ph	Ph	H	MeOCH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1020	Ph	Ph	H	HO(CH <sub>3</sub> )CH	H	Dihydroindolyl
1021	Ph	Ph	H	MeO(CH <sub>3</sub> )CH	H	Dihydroindolyl
1022	Ph	Ph	H	HOCH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> )CH	H	Dihydroindolyl
1023	Ph	Ph	H	MeOCH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> )CH	H	Dihydroindolyl
1024	Ph	Ph	H	CH <sub>3</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1025	Ph	Ph	H	2-Thienyl-CH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1026	Ph	Ph	H	2-Indolyl-CH <sub>2</sub>	H	Dihydroindolyl
1027	Ph	Me	H	i-Pr	H	Tetrahydroisoquinoliny
1028	Ph	Et	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1029	Ph	i-Pr	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1030	Ph	t-Bu	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1031	Ph	PhCH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 2)



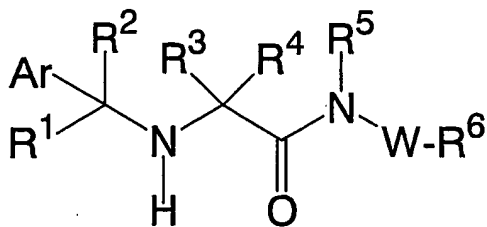
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1032	Ph	4-Pyridyl-CH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1033	Ph	CH <sub>2</sub> =CH	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1034	Ph	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1035	Ph	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1036	Ph	c-C <sub>6</sub> H <sub>9</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1037	Ph	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1038	Ph	c-C <sub>5</sub> H <sub>7</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1039	Ph	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1041	Ph	2-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1042	Ph	3-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1043	Ph	4-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1044	Ph	4-i-Pr-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1045	Ph	3-Ph-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1046	Ph	4-Ph-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1047	Ph	4-HO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1048	Ph	2-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1049	Ph	3-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1050	Ph	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1051	Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1052	Ph	4-i-PrO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1053	Ph	3-PhCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1054	Ph	4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1055	Ph	2-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1056	Ph	3-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1057	Ph	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1058	Ph	4-PhCOO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1059	Ph	4-MeNHCOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1060	Ph	4-n-PrNHCOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1061	Ph	4-Me <sub>2</sub> NCOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1062	Ph	4-EtOCOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 3)



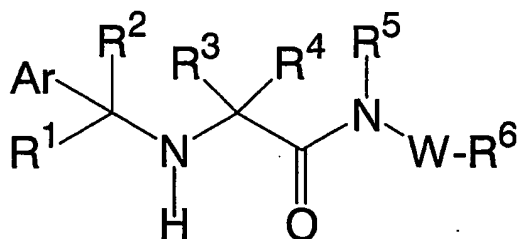
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1063	Ph	4-t-BuOCOCH <sub>2</sub> O-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1064	Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1065	Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1066	Ph	2-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1067	Ph	3-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1068	Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1069	Ph	2-Cl-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1070	Ph	3-Cl-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1071	Ph	4-Cl-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1072	Ph	4-Br-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1073	Ph	3-I-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1074	Ph	4-I-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1075	Ph	3-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1076	Ph	4-HOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1077	Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1078	Ph	4-EtOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1079	Ph	4-i-PrOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1080	Ph	4-MeSO <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1081	Ph	4-HO(Me)CH-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1082	Ph	4-MeO(Me)CH-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1083	Ph	4-H <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1084	Ph	4-MeNHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1085	Ph	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1086	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1087	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1088	Ph	4-MeCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1089	Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1090	Ph	4-HO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1091	Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1092	Ph	4-EtO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1093	Ph	4-H <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 4)



実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1094	Ph	4-MeNHCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1095	Ph	4-Me <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1096	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1097	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1098	Ph	3-I-4-HO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1099	Ph	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1100	Ph	3-F-4-HOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1101	Ph	3-F-4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1102	Ph	3-HOCH <sub>2</sub> -4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1103	Ph	3-MeOCH <sub>2</sub> -4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1104	Ph	3,4-methylenedioxy-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1105	Ph	3,4-ethylenedioxy-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1106	Ph	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1107	Ph	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1108	Ph	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1109	Ph	3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1110	4-F-Ph	4-piperadiny	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1111	4-F-Ph	N-PhCH <sub>2</sub> -4-piperadiny	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1112	4-F-Ph	N-SO <sub>2</sub> Me-4-piperadiny	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1113	2-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1114	3-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1115	4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1116	3-F-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1117	3-Me-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1118	3-CH <sub>2</sub> OMe-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1119	Pyrazinyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1120	2-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1121	3-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1122	4-CH <sub>2</sub> OMe-2-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1123	5-CH <sub>2</sub> OMe-2-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1124	2-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

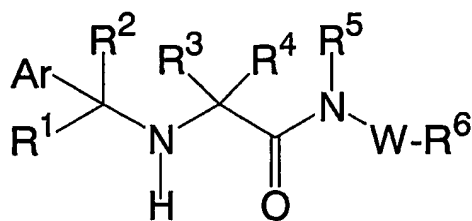
(表 5)



実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1125	4-CH <sub>2</sub> OMe-2-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1126	5-CH <sub>2</sub> OMe-2-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1127	3-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1128	2-Thiazolyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1129	4-Thiazolyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1130	5-Thiazolyl	Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1131	Ph	Ph	H	i-Pr	Me	Dihydroindolyl
1132	Ph	Ph	H	i-Pr	Et	Dihydroindolyl
1133	Ph	Ph	H	i-Pr	i-Pr	Dihydroindolyl
1134	Ph	Ph	H	i-Pr	t-Bu	Dihydroindolyl
1135	Ph	Ph	H	i-Pr	Ph	Dihydroindolyl
1136	Ph	Ph	H	i-Pr	PhCH <sub>2</sub>	Dihydroindolyl
1137	Ph	Ph	H	i-Pr	H	2-Me-Dihydroindolyl
1138	Ph	Ph	H	i-Pr	H	3-Me Dihydroindolyl
1139	Ph	Ph	H	i-Pr	H	3,3-Di-Me-Dihydroindolyl
1140	Ph	Ph	H	i-Pr	H	7-Aza-dihydroindolyl
1141	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-Me-Dihydroindolyl
1142	Ph	Ph	H	i-Pr	H	5-Me-Dihydroindolyl
1143	Ph	Ph	H	i-Pr	H	6-Me-Dihydroindolyl
1144	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-MeO-Dihydroindolyl
1145	Ph	Ph	H	i-Pr	H	5-MeO-Dihydroindolyl
1146	Ph	Ph	H	i-Pr	H	6-MeO-Dihydroindolyl
1147	Ph	Ph	H	i-Pr	H	7-MeO-Dihydroindolyl
1148	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-F-Dihydroindolyl
1149	Ph	Ph	H	i-Pr	H	5-F-Dihydroindolyl
1150	Ph	Ph	H	i-Pr	H	6-F-Dihydroindolyl
1151	Ph	Ph	H	i-Pr	H	5-Br-Dihydroindolyl
1152	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-MeO <sub>2</sub> C-Dihydroindolyl
1153	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-HO <sub>2</sub> C-Dihydroindolyl
1154	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-HOH <sub>2</sub> C-Dihydroindolyl
1155	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-MeOH <sub>2</sub> C-Dihydroindolyl

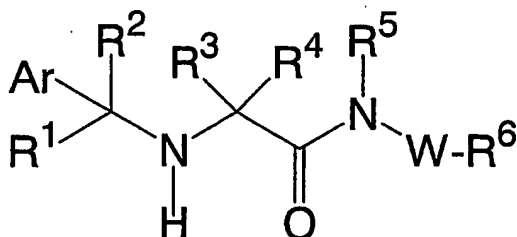


(表 6)



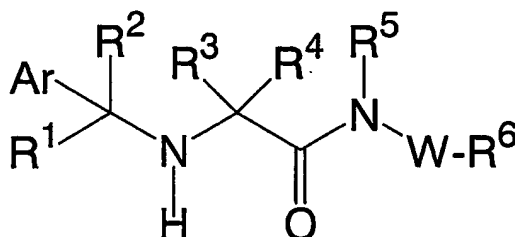
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1156	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-NH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Dihydroindolyl
1157	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-MeNHCH <sub>2</sub> -Dihydroindolyl
1158	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-Me <sub>2</sub> NCO-Dihydroindolyl
1159	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Iso-dihydroindolyl
1160	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Tetrahydroquinolyl
1161	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Tetrahydroisoquinolyl
1162	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4,5-di-OMe-tetrahydroisoquinolyl
1163	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Morpholyl
1164	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Piperidyl
1165	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-PhCH <sub>2</sub> -Piperidyl
1166	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-Ph-Piperidyl
1167	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-EtO <sub>2</sub> C-Piperidyl
1168	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-HO-Piperidyl
1169	Ph	Ph	H	i-Pr	H	4-Piperidyl-Piperidyl
1170	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-Me-Piperazyl
1171	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-PhCH <sub>2</sub> -Piperazyl
1172	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-CO <sub>2</sub> Et-Piperazyl
1173	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-COCH <sub>3</sub> -Piperazyl
1174	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-Ph-Piperazyl
1175	Ph	Ph	H	i-Pr	H	N-Pyridyl-Piperazyl
1176	4-Pyridyl	4-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1177	4-Pyridyl	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1178	4-Pyridyl	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1179	4-Pyridyl	4-PhCOO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1180	4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1181	4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1182	4-Pyridyl	4-HOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1183	4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1184	4-Pyridyl	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1185	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1186	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 7)



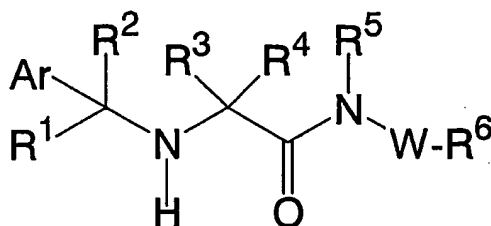
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1187	4-Pyridyl	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1188	4-Pyridyl	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1189	4-Pyridyl	4-Me <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1190	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1191	4-Pyridyl	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1192	4-Pyridyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1193	3-F-4-Pyridyl	4-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1194	3-F-4-Pyridyl	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1195	3-F-4-Pyridyl	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1196	3-F-4-Pyridyl	4-PhCOO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1197	3-F-4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1198	3-F-4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1199	3-F-4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1200	3-F-4-Pyridyl	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1201	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1202	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1203	3-F-4-Pyridyl	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1204	3-F-4-Pyridyl	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1205	3-F-4-Pyridyl	4-Me <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1206	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1207	3-F-4-Pyridyl	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1208	3-F-4-Pyridyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1209	2-Furyl	4-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1210	2-Furyl	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1211	2-Furyl	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1212	2-Furyl	4-PhCOO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1213	2-Furyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1214	2-Furyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1215	2-Furyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1216	2-Furyl	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1217	2-Furyl	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 8)



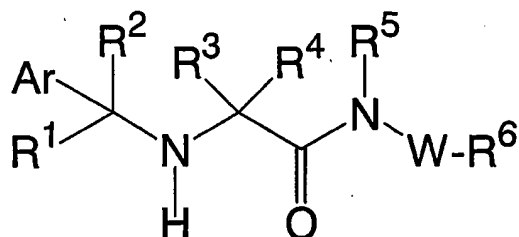
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1218	2-Furyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1219	2-Furyl	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1220	2-Furyl	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1221	2-Furyl	4-Me <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1222	2-Furyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1223	2-Furyl	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1224	2-Furyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1225	2-Thienyl	4-Me-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1226	2-Thienyl	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1227	2-Thienyl	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1228	2-Thienyl	4-PhCOO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1229	2-Thienyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1230	2-Thienyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1231	2-Thienyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1232	2-Thienyl	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1233	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1234	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1235	2-Thienyl	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1236	2-Thienyl	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1237	2-Thienyl	4-Me <sub>2</sub> NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1238	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1239	2-Thienyl	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1240	2-Thienyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1241	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1242	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1243	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1244	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1245	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1246	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1247	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1248	4-F-Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 9)



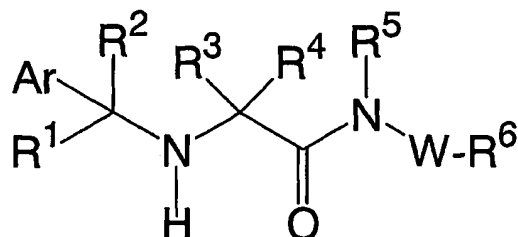
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	N(R5)WR6
1249	4-F-Ph	4-HOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1250	4-F-Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1251	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1252	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1253	4-F-Ph	4-H <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1254	4-F-Ph	4-MeNHCH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1255	4-F-Ph	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub>	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1256	4-F-Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1257	4-F-Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1258	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1259	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1260	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1261	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1262	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1263	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1264	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1265	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1266	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1267	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1268	4-PhCO-Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1269	4-PhCO-Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1270	4-PhCO-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1271	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1272	4-MeO <sub>2</sub> C-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1273	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1274	4-F-Ph	4-MeO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1275	4-F-Ph	4-MeO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub> NMeCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1276	4-F-Ph	4-MeO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1277	4-F-Ph	4-HO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl
1278	4-F-Ph	4-NCCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Dihydroindolyl

(表 10)



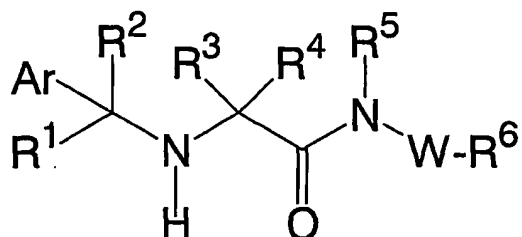
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	R5	W-R6
2001	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2002	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	Ph
2003	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Et	Ph
2004	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	2-Pyridyl
2005	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2006	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Et	2-Pyridyl
2007	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	2-Thiazolyl
2008	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2009	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Et	2-Thiazolyl
2010	Ph	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	i-Pr	H	H	Ph
2011	Ph	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2012	Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2013	Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2014	Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2015	Ph	4-Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2016	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2017	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2018	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2019	Ph	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2020	4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2021	3-F-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2022	2-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2023	2-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2024	4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2025	4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2026	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2027	4-Pyridyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2028	3-F-4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2029	3-F-4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2030	3-F-4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2031	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2032	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph

(表 1 1)



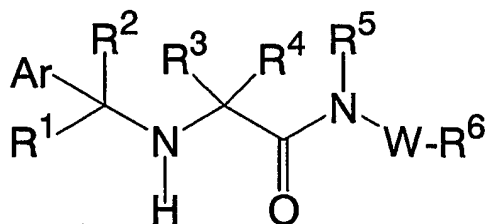
実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	R5	W-R6
2033	3-F-4-Pyridyl	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2034	2-Furyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2035	2-Furyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2036	2-Furyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2037	2-Furyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2038	2-Thienyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2039	2-Thienyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2040	2-Thienyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2041	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2042	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2043	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2044	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2045	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2046	4-F-Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2047	4-F-Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2048	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2049	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2050	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	H	Ph
2051	Ph	4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2052	Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2053	Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2054	Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2055	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2056	Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2057	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2058	4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2059	3-F-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2060	4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2061	4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2062	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2063	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2064	3-F-4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl

(表 1 2)



実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	R5	W-R6
2065	3-F-4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2066	3-F-4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2067	2-Furyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2068	2-Furyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2069	2-Furyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2070	2-Thienyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2071	2-Thienyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2072	2-Thienyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2073	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2074	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2075	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2076	4-F-Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2077	4-F-Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2078	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2079	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2080	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2081	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2082	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl
2083	Ph	4-PhO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2084	Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2085	Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2086	Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2087	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2088	Ph	4-PhCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2089	Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2090	Ph	3-I-4-MeO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2091	4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2092	3-F-4-Pyridyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2093	2-Furyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2094	2-Thienyl	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2095	4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2096	4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl

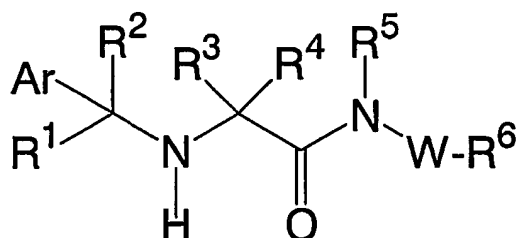
(表 1 3)



実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	R5	W-R6
2097	4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2098	4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2099	3-F-4-Pyridyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2100	3-F-4-Pyridyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2101	3-F-4-Pyridyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2102	3-F-4-Pyridyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2103	2-Furyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2104	2-Furyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2105	2-Furyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2106	2-Furyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2107	2-Thienyl	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2108	2-Thienyl	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2109	2-Thienyl	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2110	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2111	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2112	2-Thienyl	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2113	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2114	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2115	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2116	4-F-Ph	4-F-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2117	4-F-Ph	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2118	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2119	4-F-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2120	4-F-Ph	4-MeO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2121	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2122	4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCO-Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2123	4-PhCO-Ph	4-MeSO <sub>2</sub> (Me)NCH <sub>2</sub> -Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Thiazolyl
2124	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	3-Pyridyl
2125	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	3-Pyridyl
2126	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	4-Pyridyl
2127	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	4-Pyridyl
2128	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	4-Me-2-Thiazolyl



(表 1 4)



実施例	Ar	R1	R2	R3	R4	R5	W-R6
2129	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	4-Me-2-Thiazolyl
2130	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	5-Me-2-Thiazolyl
2131	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	5-Me-2-Thiazolyl
2132	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	4,5-diMe-2-Thiazolyl
2133	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	4,5-diMe-2-Thiazolyl
2134	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	4-Ph-2-Thiazolyl
2135	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	4-Ph-2-Thiazolyl
2136	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	4-Thiazolyl
2137	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	4-Thiazolyl
2138	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	5-Thiazolyl
2139	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	5-Thiazolyl
2140	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	2-Benzothiazolyl
2141	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Benzothiazolyl
2142	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	2-Imidazolyl
2143	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Imidazolyl
2144	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	2-Benzoimidazolyl
2145	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Benzoimidazolyl
2146	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	1-Tetrahydroquinoliny
2147	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	1-Tetrahydroquinoliny
2148	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	1-Tetrahydroisoquinoliny
2149	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	1-Tetrahydroisoquinoliny
2150	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	1-Dihydroindolyl
2151	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	1-Dihydroindolyl
2152	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	1-Dihydroisoindolyl
2153	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	1-Dihydroisoindolyl
2154	Ph	Ph	H	i-Pr	H	H	PhCH <sub>2</sub>
2155	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	PhCH <sub>2</sub>
2156	Ph	Ph	H	i-Pr	H	EtO <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub>	PhCH <sub>2</sub>
2157	Ph	Ph	H	i-Pr	H	PhCH <sub>2</sub>	PhCH <sub>2</sub>
2158	Ph	Ph	H	i-Pr	H	2-Pyridyl-CH <sub>2</sub>	2-Pyridyl-CH <sub>2</sub>
2159	Ph	Ph	H	i-Pr	H	Me	2-Pyridyl-CH <sub>2</sub>

これらの化合物の内、好適な化合物は、例えば1004、1008、1009、  
 1010、1011、1012、1019、1029、1035、1037、1  
 5 043、1050、1051、1057、1058、1065、1068、10

71、1072、1077、1082、1085、1086、1087、109  
1、1092、1095、1096、1097、1101、1103、1115、  
1116、1117、1118、1120、1123、1124、1126、1  
128、1140、1141、1144、1148、1152、1153、11  
5 54、1155、1156、1157、1158、1161、1177、117  
9、1180、1181、1183、1185、1186、1188、1190、  
1194、1197、1198、1199、1201、1202、1204、1  
206、1210、1213、1214、1215、1217、1218、12  
20、1222、1226、1229、1230、1231、1233、123  
10 4、1236、1238、1241、1242、1243、1244、1246、  
1248、1250、1251、1252、1257、1259、1260、1  
262、1264、1266、1269、1271、1274、1275、12  
76、1277、2001、2002、2004、2005、2007、200  
8、2011、2012、2013、2014、2016、2017、2024、  
15 2025、2026、2028、2029、2030、2031、2044、2  
045、2046、2047、2048、2049、2052、2053、20  
54、2055、2060、2061、2062、2064、2065、206  
6、2074、2075、2076、2077、2079、2081、2082、  
2084、2085、2086、2087、2091、2092、2095、2  
20 096、2097、2098、2099、2100、2101、2102、21  
04、2105、2106、2108、2109、2110、2111、211  
3、2114、2115、2116、2117、2118、2119、2120、  
2121、2122、2129、2131、2133、2154、2155、2  
156、2157、2158、2159等であり、中でも例えば1004、10  
25 08、1035、1065、1068、1077、1087、1115、111  
6、1181、1183、1186、1198、1199、1202、1230、  
1231、1234、1242、1243、1244、1250、1251、1  
274、1275、1276、2005、2008、2053、2054、20  
55、2065、2066、2077、2079、2082、2085、208

6、2087、2092、2100、2101、2102、2108、2109、2111、2117、2118、2119、2120、2121、2122の化合物等が好ましい。

- 特に、2-(ベンズヒドリルアミノ)-1-(2,3-ジヒドロ-1H-イン  
 5 ドール-1-イル)-3-メチル-1-ブタノン(1004の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(4-フルオロフェニル)(フェニル)メチル]アミノ}-3-メチル-1-ブタノン(1068の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[[4-(メトキシメチル)フェニル](フェニル)メチル]アミノ}-3-メチル-  
 10 1-ブタノン(1077の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(4-フルオロフェニル)(2-フルオロ-4-ピリジニル)メチル]アミノ}-3-メチル-1-ブタノン(1198の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(2-フルオロ-4-ピリジニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-3-メチル-1-ブタノン(1202の化合物)、  
 15 1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(4-フルオロフェニル)[4-(メトキシメチル)フェニル]メチル]アミノ}-3-メチル-1-ブタノン(1250の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(4-フルオロフェニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-3-メチル-  
 20 1-ブタノン(1251の化合物)、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-2-{[(4-フルオロフェニル)(4-{[(メトキシカルボニルメチル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-3-メチル-1-ブタノン(1274の化合物)、2-(ベンズヒドリルアミノ)-N,3-ジ  
 25 メチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2008の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)[4-(メトキシメチル)フェニル]メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(2-ピリジニル)ブタンアミド(2077の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチ

ル-N-(2-ピリジニル)ブタンアミド(2079の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)(フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2085の化合物)、2-{[[4-(メトキシメチル)フェニル](フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2086の化合物)、  
5 N,3-ジメチル-2-{[(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)(フェニル)メチル]アミノ}-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2087の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)(2-フルオロ-4-ピリジニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2100の化合物)、2-  
10 {[(2-フルオロ-4-ピリジニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2102の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2118の化合物)、2-{[(4-フルオロフェニル)(4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2119の化合物)、2-  
15 {[(4-フルオロフェニル)(4-{[(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2120の化合物)、2-{[[4-(メトキシメチル)フェニル](4-{[メチル(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)メチル]アミノ}-N,3-ジメチル-N-(1,3-チアゾール-2-イル)ブタンアミド(2121の化合物)等がさら  
20  
25 に好適な化合物である。

次に、本発明の一般式（I）の化合物の製造方法について説明する。

一般式（I）の化合物は、以下の製造法A又は製造法Bで製造することができる。

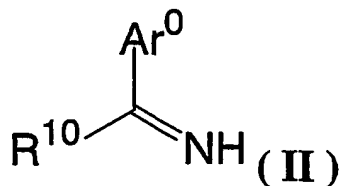
#### 製造法A

- 5 本製造法は、一般式（I）の化合物のうち、 $R^2$ が水素原子である、本発明の一般式（I-1）の化合物の製造法である。

なお、本発明の一般式（I）の化合物は、通常の液相における合成のみならず、近年発達の目覚ましい例えばコンビナトリアル合成法やパラレル合成法等の固相を用いた合成によっても製造することができる。

#### 10 （第1工程）

一般式（I I）

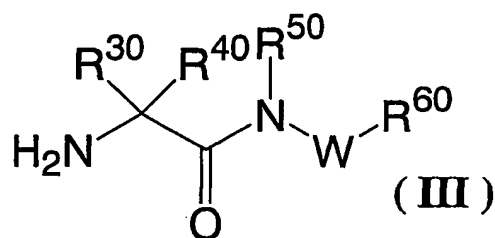


- [式中、 $\text{Ar}^0$ は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $\text{C}_3-\text{C}_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $\text{C}_3-\text{C}_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-（N-アロイルアミノ） $\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $\text{C}_2-\text{C}_6$ アルカノイル基、N- $\text{C}_2-\text{C}_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $\text{C}_2-\text{C}_6$ アルカノイルアミノ基、N- $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキルアミノ基、N- $\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $\text{C}_1$

- $-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ 、  
 $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護された $N$ -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $N$ 、  
 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、  
 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、  
 イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有

- する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{10}$ は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3$ - $C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3$ - $C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2$ - $C_6$ アルカノイル基、N- $C_2$ - $C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2$ - $C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、
- 15 N, N-ジ- $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2$ - $C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2$ - $C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノ $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選
- 25 択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1$ - $C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1$ - $C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1$ - $C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1$ - $C_9$ 脂肪族基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基並びに $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1$ - $C_{10}$ ア

ルキル基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アジ  
 リジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より  
 選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択  
 されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、  
 5 オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル  
 基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル  
 基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、  
 テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、  
 ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される 5 員若しくは 6 員のヘ  
 10 テロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インド  
 リル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、  
 キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニ  
 ル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジ  
 ニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベン  
 15 ゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキ  
 シフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からな  
 る群より選択されるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環  
 性の複素芳香環基を示す] で表されるイミン誘導体と一般式 (I I I)



20    [式中、R<sup>30</sup>は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバ  
モイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシ基、シア  
ノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ  
基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽  
和C<sub>3</sub>－C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N－アラルキルアミノ基、N，N－ジアラ  
25    ルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N－アラルキ



- ルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、
- 5 N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基
- 10 並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾ
- 15 リル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基か
- 25

- らなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、
- 5 テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、
- 10  $R^{40}$ は、水素原子又はアジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジ
- 15 アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキ
- 20 シ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N,
- 25 N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、

- $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N,N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N,N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基若しくはフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、
- 25  $R^{50}$ は、水素原子若しくはアミノ基の保護基又はアジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラル

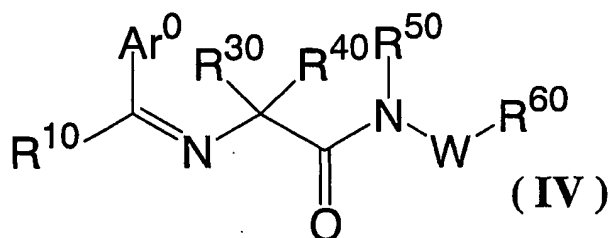
- キルアミノ基、N，N－ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N－アラルキルカルバモイル基、アリール基、N－アリールアミノ基、N，N－ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N－アリールスルホニルアミノ基、アリール
- 5 スルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N－アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N－（N－アロイルアミノ） $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N－ $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N，N－ジ－ $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N－ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N，N－ジ－ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N－ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモ
- 10 イル基、N，N－ジ－ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N－ $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N，N－ジ－ $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN－アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N－ $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N－ $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N－ $C_1-C_6$ アルキ
- 15 ルスルファモイル基、N，N－ジ－ $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N－ $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N－ $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N，N－ジ－ $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N－ $C_3-C_6$ シクロアル
- 20 キルカルバモイル基及びN，N－ジ－ $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよ
- 25 い、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フ

- ラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、  
 ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群よ  
 り選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル  
 基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェ  
 5 ニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロ  
 インドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイ  
 ソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、  
 ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフ  
 ラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、  
 10 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1な  
 いし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、アゼチ  
 ジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族  
 ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽  
 和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、  
 15  $R^{60}$ は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルア  
 ミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシル基、シアノ基、ス  
 ルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホル  
 ミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$   
 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキル  
 20 アミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカル  
 バモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、  
 アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-  
 アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモ  
 イルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N  
 25 -アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル  
 基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルア  
 ミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ  
 基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$

- アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基を示すか、又は、R<sup>50</sup>及びR<sup>50</sup>と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリ

- ジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-（N-アロイルアミノ） $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$

- アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、Wは単結合又は直鎖状若しくは分枝鎖の $C_1-C_6$ 低級アルキレン基を示す]で表されるアミン誘導体又はその塩とを反応させることにより、一般式(IV)



- [式中、 $Ar^0$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{30}$ 、 $R^{40}$ 、 $R^{50}$ 、 $R^{60}$ 及びWは、前記の意味を有する]で表される化合物に変換する。

- 通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式(II)のイミン誘導体と一般式(III)のアミン誘導体又はその塩を、適宜、酸の存在下に、 $-100^{\circ}C$ から溶媒の沸点温度、好ましくは $0\sim 30^{\circ}C$ 、 $0.5\sim 96$ 時間、好ましくは $3\sim 24$ 時間反応させることができる。

- 反応において使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって、適宜増減することができるが、通常一般式(II)のイミン誘導体に対して $0\sim 50$ 等量、好ましくは $0\sim 2$ 等量の酸存在下、 $1\sim 10$ 等量、好ましくは $1.2\sim 3$ 等量の一般式(III)のアミン誘導体又はその塩を使用する。該酸は、一種又はそれ以上適宜組み合わせ使用することができる。

- 反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、具体的には例えば塩化メチレン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、トリクロロエタン、N,N-ジメチルホルムアミド、酢酸エチルエステル、酢酸メチルエステル、アセトニトリル、無水酢酸、メチルアルコール、エチルアルコール、ベンゼン、キシレン、水、酢酸、トルエン、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン又はそれらの混合溶媒等が挙げられるが、

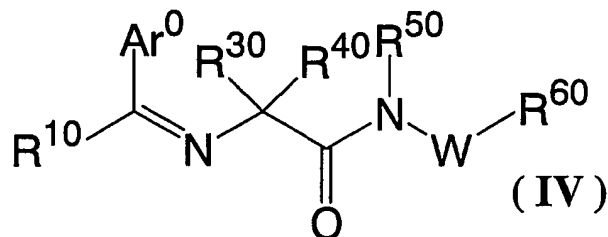


好適な反応温度の確保の点から、特に例えば塩化メチレン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン等が好適である。

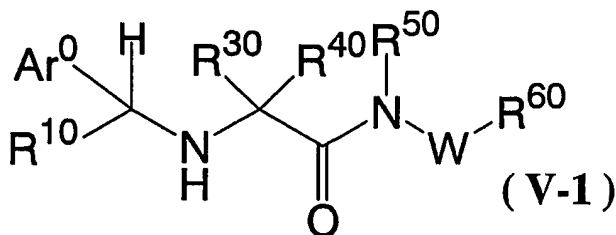
- 5 反応で使用される酸としては、例えば塩酸、硝酸、臭化水素酸、硫酸、フッ化水素酸、過塩素酸等の無機酸；例えばトリフルオロホウ酸等のルイス酸；例えば p-トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、メタンスルホン酸等のスルホン酸；蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸等が挙げられ、特に例えば塩酸等の無機酸又は例えば酢酸等の有機酸等が好適である。

(第2工程)

- 10 次に、第1工程で得られた一般式 (IV)

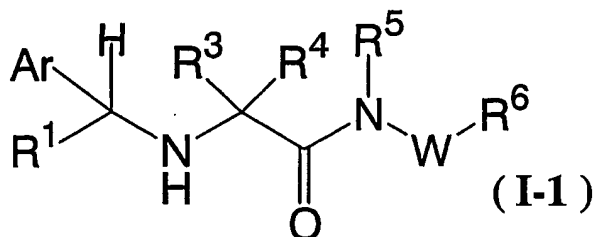


[式中、Ar<sup>0</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>30</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>50</sup>、R<sup>60</sup>及びWは、前記の意味を有する]で表される化合物を単離精製又は単離精製することなく、不活性有機溶媒中で、還元剤と反応させることにより、一般式 (V-1)



15

[式中、Ar<sup>0</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>30</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>50</sup>、R<sup>60</sup>及びWは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、次いで適宜存在する保護基を除去することにより、一般式 (I-1)



〔式中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びWは、前記の意味を有する〕で表される化合物を製造することができる。

- 反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式（IV）のイミン誘導体を還元剤と、適宜、酸存在下に、 $-100^{\circ}\text{C}$ から溶媒の沸点温度、好ましくは $0\sim 30^{\circ}\text{C}$ 、 $0.5\sim 96$ 時間、好ましくは $1\sim 5$ 時間反応させることができる。反応で使用する不活性有機溶媒及び酸は、第1工程と同様のものを使用することができる。
- 10    なお、各置換基上の官能基を保護する保護基は、保護基の種類、保護基の除去方法又は反応条件等を適宜選択することにより、例えばアミノ基の保護基（以下、N-保護基という。）、カルボキシル基の保護基、ヒドロキシ基の保護基等を同時に除去することもできる。又、N-保護基、カルボキシル基の保護基又はヒドロキシ基の保護基のいずれか一方を選択的に除去することもでき、さらには該保護基の除去順序は、特に制限されるものではない。

- ヒドロキシ基の保護基としては、例えばtert-ブチルジメチルシリル基、tert-ブチルジフェニルシリル基等の低級アルキルシリル基；例えばメトキシメチル基、2-メトキシエトキシメチル基等の低級アルコキシメチル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基等が挙げられ、特にtert-ブチルジメチルシリル基、アセチル基等が好ましい。
- 20    アミノ基の保護基としては、例えばベンジル基、p-ニトロベンジル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基；例えばエトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等の低級アルコキシカルボニル

- 25    基；例えばベンジロキシカルボニル基、p-ニトロベンジロキシカルボニル

基等のアラルキルオキシカルボニル基等が挙げられ、特にp-ニトロベンジル基、tert-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基等が好ましい。

- カルボキシ基の保護基としては、例えばメチル基、エチル基、tert-ブチル基等の低級アルキル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基等のアラルキル基等が挙げられ、特にメチル基、エチル基、tert-ブチル基、ベンジル基等が好ましい。
- 5

- 保護基の除去はその種類及び化合物の安定性により異なるが、文献記載の方法 [プロテクティブ・グループス・イン・オーガニック・シンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis), T. W. グリーン (T. W. Greene) 著、John Wiley & Sons 社 (1981) 年参照] 又はそれに準ずる方法に従って、例えば酸又は塩基を用いる加溶媒分解、水素化金属錯体等を用いる化学的還元又はパラジウム炭素触媒、ラネーニッケル触媒等を用いる接触還元等により行うことができる。
- 10

- 反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、前記の不活性溶媒が挙げられる。
- 15

- 反応で使用される還元剤としては、例えば亜鉛、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素酢酸、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素亜鉛、ジボラン、ボランジメチルスルフィド錯体、ボランテトラヒドロフラン錯体等が挙げられ、特に例えば水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素酢酸、シアノ水素化ホウ素ナトリウムが好適である。
- 20

- 反応で使用される酸としては、例えば塩酸、硝酸、臭化水素酸、硫酸、フッ化水素酸、過塩素酸等の無機酸；例えばトリフルオロホウ酸等のルイス酸；例えばp-トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、メタンスルホン酸等のスルホン酸；蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸等が挙げられ、特に例えば蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸等が好適である。
- 25

反応において使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって、適宜増減することができるが、通常一般式 (IV) のイミン誘導体に対して0~50等量、好ましくは0~2等量の酸存在下、1~50等量、好ましくは1.2~2.5等量の還元剤を使用する。該酸及び該還元剤は、一種又はそれ以上適宜組み合わせ

て使用することができる。

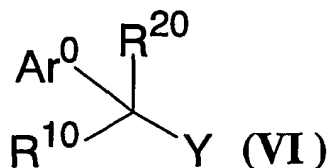
反応終了後、さらに通常の公知の方法で、生成物を精製することにより、一般式 (I) の化合物を得ることができる。反応液から一般式 (I-1) の化合物又はその塩の単離精製は、溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー等公知の分離手段により行うことができる。

#### 製造法B

本製造法は、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $R^2$  が  $\neq H$  である本発明の一般式 (I-2) の化合物の製造法である。

(第1工程)

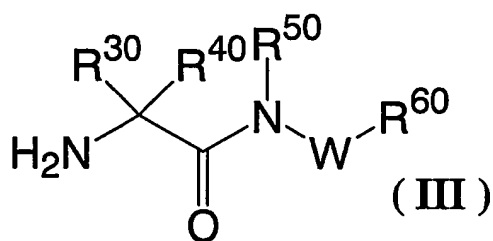
10 一般式 (VI)



[式中、 $R^{20}$ は、アジド基、適宜保護されたアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、適宜保護されたカルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、適宜保護されたヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$  脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N$ -( $N$ -アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$  アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$  アルカノイルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_2-C_6$  アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$  アルキルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $N$ ,  $N$ -ジ- $C_1-C_{10}$  アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$  アルケニルカルバモイル基、 $N$ ,  $N$ -ジ

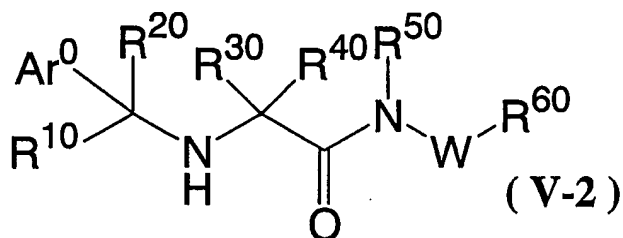
- $-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、適宜保護されたN-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ  
 5  $-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-  
 10 ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環  
 15 状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリ  
 20 ジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、  
 25 インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニ

ル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、Yは、ハロゲン原子を示し、Ar<sup>0</sup>及びR<sup>10</sup>は前記の意味を有する]で表される誘導体と一般式 (III)

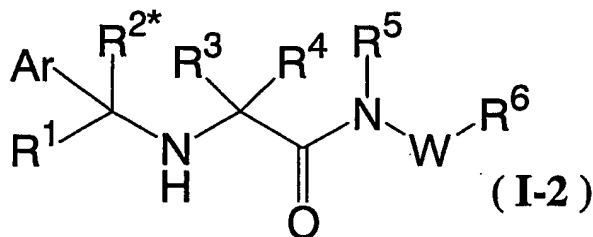


5

[式中、R<sup>30</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>50</sup>、R<sup>60</sup>及びWは、前記の意味を有する]で表されるアミン誘導体又はその塩とを不活性有機溶媒中で、適宜塩基の存在下、反応させることにより、一般式 (V-2)



- 10 [式中、Ar<sup>0</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>20</sup>、R<sup>30</sup>、R<sup>40</sup>、R<sup>50</sup>、R<sup>60</sup>及びWは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、次いで適宜存在する保護基を除去した後、適当な方法で精製することにより、一般式 (I-2)



- 15 [式中、R<sup>2\*</sup>は、水素原子を除く前記のR<sup>2</sup>、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びWは、前記の意味を有する]で表される化合物を製造することができる。

反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式 (VI) の化合物

と一般式 (I I I) のアミン誘導体とを、適宜塩基の存在下に、 $-100^{\circ}\text{C}$  から溶媒の沸点温度、好ましくは  $0\sim 30^{\circ}\text{C}$ 、 $0.5\sim 96$  時間、好ましくは  $3\sim 24$  時間反応させることができる。

反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、前記の不活性溶媒が挙げられる。

反応で使用される塩基としては、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N, N-ジメチルアニリン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカ-7-エン (DBU)、1, 5-アザビシクロ [4. 3. 0] ノナ-5-エン (DBN) 等の第3級脂肪族アミン；例えばピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、ピコリン、ルチジン、キノリン、イソキノリン等の芳香族アミン；例えば金属カリウム、金属ナトリウム、金属リチウム等のアルカリ金属；例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物；例えばブチルリチウム等のアルカリ金属アルキル化物；例えばカリウム-*tert*-ブチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムメチラート等のアルカリ金属アルコキシド；例えば水酸化カリウム、水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物；例えば炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩等が挙げられ、中でも例えばアルカリ金属水素化物、アルカリ金属アルコキシド、アルカリ金属炭酸塩が好ましく、特に例えば水素化ナトリウム、カリウム-*tert*-ブチラート、炭酸カリウムが好適である。

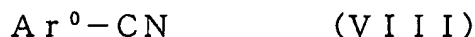
反応において使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって、適宜増減することができるが、通常一般式 (I I I) のアミン誘導体に対して  $0\sim 50$  等量、好ましくは  $1\sim 2$  等量の (V I) 及び  $0\sim 50$  等量、好ましくは  $2\sim 4$  等量の塩基を使用する。

25    なお、一般式 (I I) のイミン誘導体は、文献公知であるか、又は一般式 (V I I)



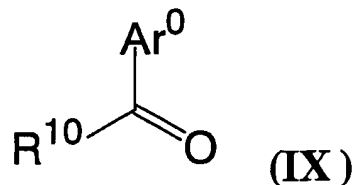
〔式中、Yは、ハロゲン原子を示し、 $\text{R}^{10}$ は、前記の意味を有する〕で表されるハロゲン化合物と金属マグネシウムとを、例えばジエチルエーテル、テトラヒ

ドロフラン等適当なエーテル系脱水溶媒中、低温から溶媒の沸点温度で反応させることにより調製されるグリニアル試薬と、一般式 (VII I)

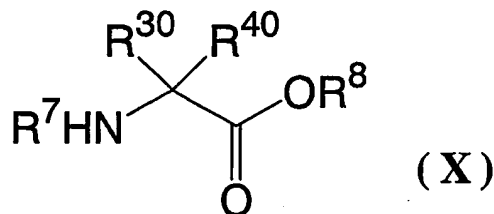


- 5 [式中、 $\text{Ar}^0$ は、前記の意味を有する] で表されるシアノ化合物とを、前記の脱水した不活性有機溶媒中、低温から溶媒の沸点温度で反応させることにより製造することができる。なお、一般式 (VII I) の化合物及び一般式 (VII I) の化合物は公知化合物又は文献記載の方法で製造することができる。

また、一般式 (I I) の化合物は、一般式 (IX)



- 10 [式中、 $\text{Ar}^0$ 及び $\text{R}^{10}$ は、前記の意味を有する] の化合物の置換又は非置換のケトン体と四塩化チタンとを、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、トルエン等適当な脱水溶媒中、低温から室温で反応させることにより調製される中間体をアンモニアガスで処理することにより製造することができる。なお、一般式 (IX) の化合物は公知化合物又は文献記載の方法で製造することができる。
- 15 なお、一般式 (I I I) の化合物は、文献公知であるか、一般式 (X)



- [式中、 $\text{R}^7$ は、水素原子、アミノ基の保護基又はペプチドの固相合成におけるアミノ基の樹脂担体を示し、 $\text{R}^8$ は、水素原子又はカルボキシル基の保護基、 $\text{R}^3$ 及び $\text{R}^{40}$ は前記の意味を有する] で表されるアミノ酸又はアミノ酸より導くことのできるアミノ酸誘導体のカルボン酸と
- 20 一般式 [XI]





〔式中、 $R^{50}$ 及び $R^{60}$ は前記の意味を有する〕で表されるアミン誘導体とを反応させ、次いで $R^7$ がアミノ基の保護基の場合は当該アミノ基の保護基を除去することにより製造できる。なお、一般式(X)の化合物及び一般式(XII)の化合物は公知化合物又は文献記載の方法で製造することができる。

- 5     また、ペプチドの固相合成におけるアミノ基の樹脂担体としては、具体的には例えばポリエチレンージビニルベンゼン共重合体、ポリスチレンージビニルベンゼン共重合体等が挙げられる。またこれらの重合体にポリエチレングリコールを挟んだ樹脂を使用することもでき、中でもアミノ基の樹脂担体としては、トリチルクロリド樹脂[Trityl Chloride Resin]が好適である。
- 10    反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式(X)のアミノ酸誘導体のカルボン酸と一般式(XI)のアミン誘導体とを、適宜塩基、縮合補助剤及び／又は縮合剤の存在下に、 $-100^{\circ}\text{C}$ から溶媒の沸点温度、好ましくは $0\sim 30^{\circ}\text{C}$ 、 $0.5\sim 96$ 時間、好ましくは $3\sim 24$ 時間反応させることができる。
- 15    次いで縮合化合物がアミノ基の保護基を有する場合は、適宜当該保護基を除去することにより、反応は完結する。

反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、前記の不活性溶媒が挙げられる。

- 20    反応で使用される塩基としては、前記の塩基が挙げられ、中でも例えば第3級脂肪族アミン等が好ましく、特に例えばトリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等が好適である。

- 25    反応で使用される縮合補助剤としては、例えばN-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物、N-ヒドロキシスクシンイミド、N-ヒドロキシ-5-ノルボルネン-2,3-ジカルボキシイミド、3-ヒドロキシ-3,4-ジヒドロ-4-オキソ-1,2,3-ベンゾトリアゾール等が挙げられ、中でも例えばN-ヒドロキシベンゾトリアゾール等が好適である。

反応で使用される縮合剤としては、例えば塩化チオニル、N,N-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-メチル-2-ブロモピリジニウムアイオダイド、N,N'-カルボニルジイミダゾール、ジフェニルフォスフォルクロリド、ジフェ

- ニルフォスフォリルアジド、N, N' -ジスクシニミジルカルボネート、N, N' -ジスクシニミジルオキサレート、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル、ベンゾトリアゾ-1-リル-オキシートリス(ジメチルアミノ)フォスフォニウムヘキサフルオロフォスフェイト等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル等が好適である。

- 反応において使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって、適宜増減することができるが、通常一般式一般式(X)のアミノ酸誘導体のカルボン酸に対して0.02~50等量、好ましくは0.2~2等量のと一般式(XI)のアミン誘導体を、1~50等量、好ましくは3~5等量の塩基、1~50等量、好ましくは1~5等量の縮合補助剤及び/又は1~50等量、好ましくは1~5等量の縮合剤を使用する。該塩基、該縮合補助剤及び該縮合剤は、一種又はそれ以上適宜組み合わせ使用することができる。

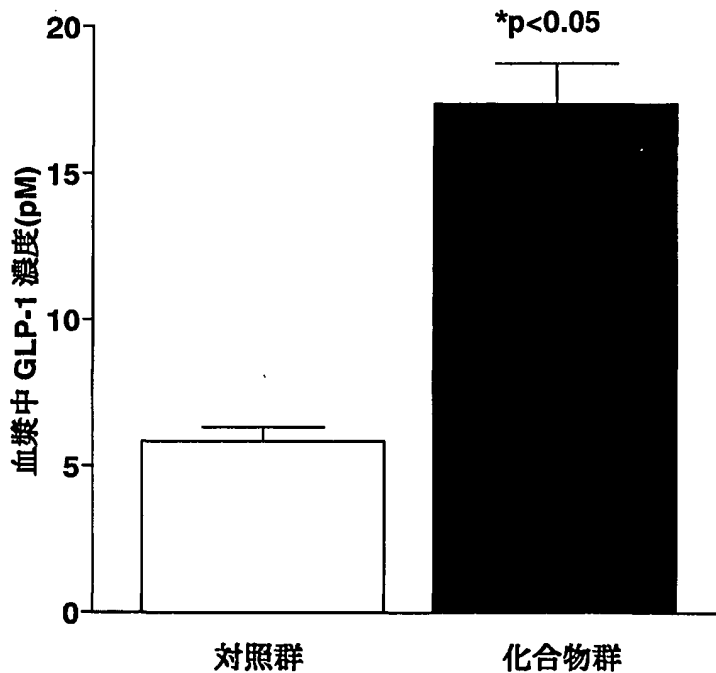
- 次に、本発明の有用性を具体的に示すため、実施例1274の化合物を代表化合物とし、該化合物投与後の血漿中GLP-1濃度への影響を検討した。その試験方法及び結果を以下に示す。

＝試験方法＝

- 自由摂食、摂水条件で飼育した雄性ウィスターラット(第9週令、n=6)を、試験前夜から絶食し、1%カルボキシメチルセルロース溶液に懸濁した化合物を投与した。なお、対照群としては、1%カルボキシメチルセルロース溶液をラットに経口投与した。被検薬剤投与30分後に採血を行い、得られた血液から遠心分離を行って血漿を分離した。血漿中のGLP-1濃度は市販の抗GLP-1抗体(コスモバイオ(株))を用い、ラジオイムノアッセイ法で定量した。得られた数値は、Student T検定を用いて解析を行い、その統計学的有意差を算出した。その結果を下記の表に示す。

=試験結果=

(表 15)

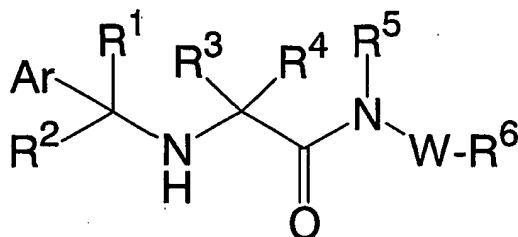


BEST AVAILABLE COPY

- 5 以上の結果より、投与後 30 分に於いて、10 mg/kg の化合物を投与された群の血漿では対照群と比較して有意に高値な血中 GLP-1 が認められた。この結果より、本発明の化合物はラットにおいて高い血中 GLP-1 濃度を呈することの出来る活性を持つことが示された。

本発明化合物は、高い血中 GLP-1 濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬として有用である。

- 10 本発明の一般式 (I) の化合物は、それを有効成分とする医薬、特に糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬として使用することができるが、かかる医薬、特に糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬における本発明の化合物は、医薬上許容される慣用的なものを意味し、例えば一般式 (I)



- [式中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びWは、前記の意味を有する]  
 で表される化合物、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>又はR<sup>6</sup>上のカルボキシル  
 基における医薬として許容されるエステル若しくは塩、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、  
 5 R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>又はR<sup>6</sup>上の水酸基における塩又はAr、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、  
 R<sup>6</sup>又はNH上のアミノ基における塩が包含される。

該カルボキシル基又はヒドロキシ基における塩としては、例えばナトリウム塩、  
 カリウム塩等のアルカリ金属塩；例えばカルシウム塩、マグネシウム塩等のアル  
 カリ土類金属塩等が挙げられる。

- 10 該アミノ基における酸付加塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、りん  
 酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩、過塩素酸塩等の無機酸塩；例えば酢酸塩、プロピオン  
 酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、りんご酸塩、くえん  
 酸塩、アスコルビン酸塩等の有機酸塩；例えばメタンスルホン酸塩、イセチオン  
 酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩；例えば  
 15 アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩等の酸性アミノ酸塩等が挙げられる。

本発明化合物は、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤あるいは抗肥満  
 薬として使用される場合には、その薬学的に許容しうる塩としても使用すること  
 ができる。薬学的に許容しうる塩の典型例としては、例えばナトリウム、カリウ  
 ム等のアルカリ金属との塩等を挙げることができる。

- 20 本発明の化合物の薬学的に許容しうる塩の製造法は、有機合成化学分野で通常  
 用いられる方法を適宜組み合わせで行うことができる。具体的には、本発明化合  
 物の遊離型の溶液をアルカリ溶液中で中和滴定すること等が挙げられる。

- 本発明化合物を糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤あるいは抗肥満薬  
 として使用する際の投与形態としては各種の形態を選択でき、例えば錠剤、カプ  
 25 セル剤、散剤、顆粒剤、液剤等の経口剤、例えば溶液、懸濁液等の殺菌した液状

の非経口剤等が挙げられる。

- 固体の製剤は、そのまま錠剤、カプセル剤、顆粒剤又は粉末の形態として製造することもできるが、適当な添加物を使用して製造することもできる。該添加物としては、例えば乳糖、ブドウ糖等の糖類、例えばトウモロコシ、小麦、米等の
- 5 澱粉類、例えばステアリン酸等の脂肪酸、例えばメタケイ酸ナトリウム、アルミン酸マグネシウム、無水リン酸カルシウム等の無機塩、例えばポリビニルピロリドン、ポリアルキレングリコール等の合成高分子、例えばステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム等の脂肪酸塩、例えばステアリルアルコール、ベンジルアルコール等のアルコール類、例えばメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等の合
- 10 成セルロース誘導体、その他、水、ゼラチン、タルク、植物油、アラビアゴム等通常用いられる添加物等が挙げられる。

- これらの錠剤、カプセル剤、顆粒剤、粉末等の固形製剤は、一般的には0.1～100重量%、好ましくは5～100重量%の有効成分を含むことができる。
- 15 液状製剤は、水、アルコール類又は例えば大豆油、ピーナツ油、ゴマ油等の植物由来の油等液状製剤において通常用いられる適当な添加物を使用し、懸濁液、シロップ剤、注射剤等の形態として製造することができる。特に、非経口的に投与する場合の適当な溶剤としては、例えば注射用蒸留水、塩酸リドカイン水溶液（筋肉内注射用）、生理食塩水、ブドウ糖水溶液、エタノール、静脈内注射用液体（例
- 20 えばクエン酸、クエン酸ナトリウム等の水溶液）、電解質溶液（例えば点滴静注、静脈内注射用）等又はこれらの混合溶液が挙げられる。

又、経口投与の懸濁剤又はシロップ剤等の液剤は、0.5～10重量%の有効成分を含むことができる。

- 本発明の化合物の実際に好ましい投与量は、使用される化合物の種類、配合された組成物の種類、適用頻度および治療すべき特定部位および患者の病状によ
- 25 て適宜増減することができる。例えば、一日当りの成人一人当りの投与量は、経口投与の場合、0.1ないし1000mgであり、非経口投与の場合、1日当り0.01ないし500mgである。なお、投与回数は、投与方法および症状により異なるが、単回又は2ないし5回に分けて投与することができる。

実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明はこれらによって何ら限定されるものではない。

実施例の薄層クロマトグラフは、プレートとしてSilicagel 60F<sub>245</sub> (Merck) を、検出法としてUV検出器を用いた。カラム用シリカゲルとしては、Wakogel<sup>TM</sup> C-300 (和光純薬) を、逆相カラム用シリカゲルとしては、LC-SORB<sup>TM</sup> SP-B-ODS (Chemco) 又はYMC-GEL<sup>TM</sup> ODS-AQ 120-S50 (山村化学研究所) を用いた。

下記の実施例の記載における略号の意味を以下に示す。

- i-Bu : イソブチル基
- 10 n-Bu : n-ブチル基
- t-Bu : t-ブチル基
- Me : メチル基
- Et : エチル基
- Ph : フェニル基
- 15 i-Pr : イソプロピル基
- n-Pr : n-プロピル基
- CDCl<sub>3</sub> : 重クロロホルム
- methanol-d<sub>4</sub> : 重メタノール
- DMSO-d<sub>6</sub> : 重ジメチルスルホキシド
- 20 (実施例)
- 実施例1004
- 2-(ベンズヒドリルアミノ)-1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-3-メチル-1-ブタノン
- N-t-ブトキシカルボニル-D-パリン10g (46.0mmol)、イン
- 25 ドリン5.68ml (50.6mmol) 及びトリエチルアミン19.2ml (138.9mmol) の塩化メチレン溶液(100ml)に、氷冷下、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物11.3g (69.1mmol) 及び1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩13.2g (69.1mmol) を加え室温で反応液を一晩攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウ

ム水溶液を添加し、クロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチルエステル＝8：1）により精製し、アミド10.3g（収率：70%）を無色油状物として得た。

- 5 得られたアミド10.0g（31.4mmol）を室温で4N塩酸の1,4-ジオキサン溶液（50ml）に溶解し、室温で、反応液を4時間攪拌後、減圧下に濃縮し、アミン塩酸塩7.9g（収率：100%）を白色固体として得た。

- 得られたアミン塩酸塩700mg（2.5mmol）の塩化メチレン（20ml）溶液にベンゾフェノンイミン450mg（2.5mmol）を加え、反応液  
10 を室温で一晩攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩化メチレン（20ml）に溶解し、シアノ水素化ホウ素ナトリウム500mg（mmol）及び酢酸0.5mlを加え、反応液を室温で1時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加し、クロロホルムで抽出し、有機層を蒸留水及び飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下に濃縮した。  
15 得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチルエステル＝8：1）により精製し、表題化合物910mg（収率：92%）を無色油状物として得た。

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.8Hz), 1.13 (3H, d, J=6.8Hz), 1.89-1.96 (1H, m), 3.03 (2  
20 H, t, J=8.4Hz), 3.16 (1H, d, J=6.7Hz), 3.41 (1H, dt, J=10.0Hz, 8.9Hz), 3.76 (1H, t, J=10.0Hz, 8.9Hz), 4.76 (1H, s), 7.02-7.35 (9H, m), 7.40 (2H, d, J=7.6Hz), 7.49 (2H, d, J=7.6Hz), 8.38 (1H, d, J=8.8Hz)  
25 ESI-MS (m/e): 385 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1004と同様にして、前記の化合物リストの化合物例番号に対応する実施例1002、1003、1004、1008、1018、1019、1137、1138、1139、1140、1141、1142、143、1144、1145、1146、1147、1148、1149、1150、1151、1

152、1153、1154、1155、1156、1157、1158、1159、1160、1161、1163、1164、1165、1167、1170、1171、1172、1174、2001、2002、2004、2005、2006、2007、2008、2124、2126、2128、2130、2132及び実施例2134の化合物を得た。以下にこれらの化合物の内、代表例の化合物の物理定数を示す。

実施例1001 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: Me; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.33 (3H, d, J=6.9Hz), 3.07 (2H, t, J=8.5Hz), 3.42-3.55 (2H, m), 3.75 (1H, q, J=8.6Hz), 4.82 (1H, s), 7.04 (1H, t, J=7.0Hz), 7.15-7.46 (12H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e): 357 [M+H]<sup>+</sup>

15 実施例1002 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: Et; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.06 (3H, t, J=7.4Hz), 1.63-1.74 (2H, m), 3.04 (2H, t, J=8.5Hz), 3.31 (1H, t, J=6.6Hz), 3.46 (1H, dt, J=8.5Hz, 18.5Hz), 3.75 (1H, dt, J=8.5Hz, 18.5Hz), 4.80 (1H, s), 7.04 (1H, t, J=7.4Hz), 7.14-7.48 (12H, m), 8.35 (1H, d, J=8.2Hz)

ESI-MS (m/e): 371 [M+H]<sup>+</sup>

25 実施例1003 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: n-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.90 (3H, t, J=7.1Hz), 1.45-1.67 (4H, m), 3.05 (2H, t, J=8.8Hz), 3.34-3.39 (1H, m), 3.45 (1H, dt, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.73 (1H, dt, J=8.8Hz, 8.8Hz), 4.79 (1H, s),



7. 04 (1H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 7. 14-7. 48 (12H, m),

8. 35 (1H, d,  $J=7.9\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 385  $[M+H]^+$

実施例1008 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *t*-Bu;  $R^4$ :

5 H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1. 08 (9H, s), 2, 98 (2H, t,  $J=$

8. 4Hz), 3. 19 (1H, s), 3. 32 (1H, m), 3. 75 (1H,

m), 4. 71 (1H, s), 7. 04 (1H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 7. 1

2-7. 39 (10H, m), 7. 48 (2H, d,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 8. 3

10 6 (1H, d,  $J=8.2\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[M+H]^+$

実施例1018 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ :  $\text{HOCH}_2$ ;  $R^4$ :

H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 3. 08 (2H, t,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 3. 58

15 -3. 68 (3H, m), 3. 75-3. 85 (2H, m), 4. 88 (1H,

s), 7. 06 (1H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 7. 16-7. 45 (12H,

m), 8. 28 (1H, d,  $J=7.9\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 373  $[M+H]^+$

実施例1019 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ :  $\text{MeOCH}_2$ ;  $R^4$ :

20 H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 3. 03 (2H, t,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 3. 28

(3H, s), 3. 38-3. 48 (1H, m), 3. 55 (1H, t,  $J=9.$

9Hz), 3. 66-3. 71 (2H, m), 3. 92-4. 13 (1H, m),

4. 83 (1H, s), 7. 05-7. 46 (13H, m), 8. 36 (1H,

25 d,  $J=11\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 387  $[M+H]^+$

実施例1137 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ :

H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : 2-Me-Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.87 (3H, d,  $J=5.4\text{Hz}$ ), 0.98–1.10 (3H, brs), 1.14 (3H, d,  $J=5.2\text{Hz}$ ), 1.91–2.03 (1H, m), 2.57 (1H, d,  $J=16\text{Hz}$ ), 3.26–3.37 (2H, m), 4.20–4.24 (1H, brs), 4.83 (1H, s), 7.07 (1H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.13–7.59 (12H, m), 8.35 (1H, d,  $J=7.9\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[\text{M}+\text{H}]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.04–1.06 (6H, m), 1.24 (3H, d,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 1.99–2.05 (1H, m), 2.45 (1H, d,  $J=16\text{Hz}$ ), 3.15–3.23 (2H, m), 3.69–3.73 (1H, m), 4.75 (1H, s), 7.04–7.54 (13H, m), 8.17 (1H, d,  $J=7.9\text{Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[\text{M}+\text{H}]^+$

15 実施例1138 (Ar: Ph;  $\text{R}^1$ : Ph;  $\text{R}^2$ : H;  $\text{R}^3$ : *i*-Pr;  $\text{R}^4$ : H; N( $\text{R}^5$ ) W- $\text{R}^6$ : 3-Me-Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 1.13 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.21–1.28 (3H, m), 1.91–2.03 (1H, m), 2.94–3.00 (1H, m), 3.25–3.35 (2H, m), 3.48–3.58 (1H, m), 4.77 (1H, s), 7.08–7.51 (13H, m), 8.32–8.37 (1H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[\text{M}+\text{H}]^+$

ジアステレオマーB

25  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 1.13 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.21–1.28 (3H, m), 1.91–2.03 (1H, m), 3.16–3.18 (1H, m), 3.25–3.35 (2H, m), 3.90 (1H, t,  $J=9.5\text{Hz}$ ), 4.77 (1H, s), 7.08–7.51 (13H, m), 8.32–8.37 (1H, m)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1139 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:N  
(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>:3,3-Me<sub>2</sub>-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.7Hz), 1.14  
5 (3H, d, J=6.6Hz), 1.23 (3H, s), 1.26 (3H, s),  
1.87-1.98 (1H, m), 3.14 (1H, d, J=8.1Hz), 3.  
17 (1H, d, J=10.0Hz), 3.49 (1H, d, J=10.0Hz),  
4.76 (1H, s), 7.09-7.49 (13H, m), 8.34 (1H,  
d, J=8.3Hz)

10 ESI-MS (m/e) : 413 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1140 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N (R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>:7-Aza-dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.9Hz), 1.03  
(3H, d, J=6.7Hz), 1.92-1.98 (1H, m), 2.99 (2  
15 H, t, J=8.2Hz), 3.97-4.15 (2H, m), 4.72 (1H,  
s), 4.93-4.94 (1H, brs), 6.75 (1H, dd, J=5.  
1Hz, 7.4Hz), 7.10-7.39 (11H, m), 7.81 (1H,  
d, J=4.4Hz)

ESI-MS (m/e) : 386 [M+H]<sup>+</sup>

20 実施例1141 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N (R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>:4-Me-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12  
(3H, d, J=6.7Hz), 1.89-1.95 (1H, m), 2.23 (3  
H, s), 2.92 (2H, t, J=8.8Hz), 3.15 (1H, d, J=  
25 6.4Hz), 3.42 (1H, dt, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.7  
6 (1H, dt, J=8.8Hz, 8.8Hz), 4.75 (1H, s), 6.  
89 (1H, d, J=7.7Hz), 7.14-7.51 (11H, m), 8.  
21 (1H, d, J=8.0Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1142 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:5-Me-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.98 (3H, d, J=7.0Hz), 1.13  
(3H, d, J=6.6Hz), 1.85-1.97 (1H, m), 2.33 (2  
5 H, s), 2.98 (2H, t, J=8.3Hz), 3.12 (1H, d, J=  
6.5Hz), 3.37 (1H, dt, J=10.1Hz, 8.3Hz), 3.  
72 (1H, dt, J=10.1Hz, 8.3Hz), 4.75 (1H, s),  
7.00 (1H, s), 7.04 (1H, d, J=8.2Hz), 7.15-7.  
33 (6H, m), 7.39 (2H, d, J=7.5Hz), 7.47 (2H,  
10 d, J=6.9Hz), 8.24 (1H, d, J=8.2Hz)

ESI-MS (m/e): 399 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1143 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:6-Me-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12  
15 (3H, d, J=6.7Hz), 1.90-1.95 (1H, m), 2.38 (3  
H, s), 2.97 (2H, t, J=8.9Hz), 3.14 (1H, d, J=  
6.9Hz), 3.39 (1H, dt, J=8.9Hz, 8.9Hz), 3.7  
3 (1H, dt, J=8.9Hz, 8.9Hz), 4.75 (1H, s), 6.  
87 (1H, d, J=7.3Hz), 7.05-7.51 (11H, m), 8.  
20 23 (1H, s)

ESI-MS (m/e): 399 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1144 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:4-MeO-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12  
25 (3H, d, J=6.7Hz), 1.90-1.98 (1H, m), 2.94 (2  
H, t, J=8.8Hz), 3.12 (1H, d, J=6.3Hz), 3.34  
(1H, dt, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.76 (1H, dt, J=8.  
8Hz, 8.8Hz), 3.84 (3H, s), 4.74 (1H, s), 6.6  
2 (1H, d, J=8.2Hz), 7.13-7.49 (11H, m), 7.9

9 (1H, d, J=8.2 Hz)

ESI-MS (m/e) : 415 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1145 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:5-MeO-Dihydroindolyl)

5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.98 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.13  
(3H, d, J=6.8 Hz), 1.88-1.95 (1H, m), 2.98 (2  
H, t, J=8.9 Hz), 3.12 (1H, d, J=6.9 Hz), 3.37  
(1H, dt, J=8.9 Hz, 8.9 Hz), 3.73 (1H, dt, J=8.  
9 Hz, 8.9 Hz), 3.79 (3H, s), 4.75 (1H, s), 6.7  
10 5 (2H, s), 7.13-7.57 (10H, m), 8.29 (1H, d, J  
=9.4 Hz)

ESI-MS (m/e) : 415 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1146 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:6-MeO-Dihydroindolyl)

15 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=7.0 Hz), 1.12  
(3H, d, J=7.1 Hz), 1.86-1.97 (1H, m), 2.94 (2  
H, t, J=8.2 Hz), 3.13 (1H, d, J=6.6 Hz), 3.40  
(1H, dt, J=9.1 Hz, 8.2 Hz), 3.77 (1H, dt, J=9.  
1 Hz, 8.2 Hz), 3.84 (s, 3H), 4.74 (1H, s), 6.6  
20 1 (1H, dd, J=2.8 Hz, 8.7 Hz), 7.04 (1H, d, J=8.  
7 Hz), 7.12-7.48 (10H, m), 8.07 (1H, d, J=2.  
8 Hz)

ESI-MS (m/e) : 415 [M+H]<sup>+</sup>

实施例1147 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:  
25 H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:7-MeO-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.93 (6H, d, J=7.1 Hz), 1.71  
-1.81 (1H, m), 2.85-2.92 (2H, m), 3.50 (3H,  
s), 3.64 (1H, d, J=4.9 Hz), 3.95 (2H, t, J=7.  
6 Hz), 4.73 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.

8.8 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 6.99–7.39 (11H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 415  $[M+H]^+$

实施例1148 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H;  $N(R^5)$  W- $R^6$ : 4-F-Dihydroindolyl)

5  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.12 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.87–1.97 (1H, m), 3.03 (2H, t,  $J=8.9$  Hz), 3.13 (1H, d,  $J=6.9$  Hz), 3.37–3.52 (1H, m), 3.79 (1H, dt,  $J=8.9$  Hz, 8.9 Hz), 4.73 (1H, s), 6.76 (1H, t,  $J=8.5$  Hz), 7.16–7.48 (11H, m), 8.13 (1H, d,  $J=8.2$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 403  $[M+H]^+$

实施例1149 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H;  $N(R^5)$  W- $R^6$ : 5-F-Dihydroindolyl)

15  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.12 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.90–2.00 (1H, m), 3.00 (2H, t,  $J=8.5$  Hz), 3.13 (1H, d,  $J=6.9$  Hz), 3.39 (1H, dt,  $J=8.5$  Hz, 8.5 Hz), 3.76 (1H, dt,  $J=8.5$  Hz, 8.5 Hz), 4.74 (1H, s), 6.86–6.95 (2H, m), 7.13–7.49 (10H, m), 8.32 (1H, dd,  $J=8.8$  Hz, 4.9 Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 403  $[M+H]^+$

实施例1150 (Ar: Ph;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H;  $N(R^5)$  W- $R^6$ : 6-F-Dihydroindolyl)

25  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.5$  Hz), 1.12 (3H, d,  $J=6.5$  Hz), 1.84–1.96 (1H, m), 2.97 (2H, t,  $J=8.2$  Hz), 3.13 (1H, d,  $J=6.3$  Hz), 3.41 (1H, dt,  $J=8.7$ , 8.2 Hz), 3.79 (1H, dt,  $J=8.7$ , 8.2 Hz), 4.74 (1H, s), 6.72–6.75 (1H, m), 7.08 (1H, dd,  $J=7.1$ , 7.1 Hz), 7.13–7.35 (6H, m),

7. 39 (2H, d,  $J=6.3$  Hz), 7. 47 (2H, d,  $J=7.0$  Hz),  
8. 12 (1H, dd,  $J=10.5, 2.3$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ) : 403  $[M+H]^+$

实施例1151 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
5 N ( $R^5$ ) W- $R^6$ :5-Br-Dihydroindolyl)

$^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 0. 99 (3H, d,  $J=6.5$  Hz), 1. 12  
(3H, d,  $J=7.0$  Hz), 1. 83-1. 96 (1H, m), 3. 00 (2  
H, t,  $J=8.2$  Hz), 3. 13 (1H, d,  $J=6.5$  Hz), 3. 36  
(1H, dt,  $J=10.0$  Hz, 8. 2 Hz), 3. 74 (1H, dt,  $J=$   
10. 0 Hz, 8. 2 Hz), 4. 73 (1H, s), 7. 14-7. 49 (1  
3H, m), 8. 22 (1H, d,  $J=8.2$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ) : 465  $[M+H]^+$

实施例1152 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
N ( $R^5$ ) W- $R^6$ :4-MeOOC-Dihydroindolyl)  
15  $^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 1. 00 (3H, d,  $J=7.0$  Hz), 1. 12  
(3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1. 87-1. 99 (1H, m), 3. 17 (1  
H, d,  $J=6.6$  Hz), 3. 32-3. 45 (3H, m), 3. 72-3.  
81 (1H, m), 3. 90 (3H, s), 4. 74 (1H, s), 7. 12-  
7. 48 (11H, m), 7. 70 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8. 59 (1  
20 H, d,  $J=7.7$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ) : 443  $[M+H]^+$

实施例1153 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
N ( $R^5$ ) W- $R^6$ :4-HOOC-Dihydroindolyl)

$^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 1. 03 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 1. 15  
25 (3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1. 88-2. 05 (1H, m), 3. 21 (1  
H, br), 3. 32-3. 49 (3H, m), 3. 73-3. 86 (1H, m),  
4. 78 (1H, s), 7. 14-7. 56 (11H, m), 7. 80 (1H,  
d,  $J=7.4$  Hz), 8. 67 (1H, d,  $J=7.6$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ) : 429  $[M+H]^+$

実施例1154 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:4-HOCH<sub>2</sub>-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.06 (3H, d, J=7.0Hz), 1.17  
(3H, d, J=7.0Hz), 1.92-2.05 (1H, m), 3.10 (2  
5 H, t, J=8.3Hz), 3.23 (1H, br), 3.47 (1H, dt,  
J=8.7Hz, 8.3Hz), 3.83 (1H, dt, J=9.9Hz, 8.  
3Hz), 4.69 (2H, s), 4.82 (1H, s), 7.11-7.58  
(12H, m), 8.39 (1H, d, J=7.8Hz)

ESI-MS (m/e): 415 [M+H]<sup>+</sup>

10 実施例1155 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:4-MeOCH<sub>2</sub>-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.5Hz), 1.13  
(3H, d, J=6.5Hz), 1.88-1.95 (1H, m), 3.03 (2  
H, t, J=8.4Hz), 3.15 (1H, d, J=7.0Hz), 3.38  
15 (3H, s), 3.43 (1H, dt, J=10.3Hz, 8.4Hz), 3.  
77 (1H, dt, J=10.3Hz, 8.4Hz), 4.41 (2H, s),  
4.74 (1H, s), 7.03 (1H, d, J=7.6Hz), 7.14-7.  
35 (7H, m), 7.39 (2H, d, J=6.8Hz), 7.48 (2H,  
d, J=6.8Hz), 8.34 (1H, d, J=7.9Hz)

20 ESI-MS (m/e): 429 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1156 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:4-H<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>-Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=7.1Hz), 1.12  
(3H, d, J=7.1Hz), 1.82-1.96 (1H, m), 3.00 (2  
25 H, t, J=8.6Hz), 3.14 (1H, d, J=6.5Hz), 3.43  
(1H, dt, J=10.8Hz, 8.6Hz), 3.77 (1H, dt, J=  
10.8Hz, 8.6Hz), 3.80 (2H, s), 4.74 (1H, s),  
7.04 (1H, d, J=7.6Hz), 7.16 (1H, d, J=7.2Hz),  
7.22-7.37 (6H, m), 7.38 (2H, d, J=6.9Hz), 7.



4.7 (2H, d,  $J=6.9$  Hz), 8.29 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 414  $[M+H]^+$

实施例1157 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
N( $R^5$ )W- $R^6$ :4-MeNHCH<sub>2</sub>-Dihydroindolyl)

- 5  $^1$ HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1.12  
(3H, d,  $J=6.6$  Hz), 1.86-1.99 (1H, m), 2.48 (3  
H, s), 3.05 (2H, t,  $J=8.4$  Hz), 3.14 (1H, d,  $J=$   
6.5 Hz), 3.45 (1H, dt,  $J=10.0$  Hz, 8.4 Hz), 3.  
71 (2H, s), 3.77 (1H, dt,  $J=10.0$  Hz, 8.4 Hz),  
10 4.74 (1H, s), 7.04 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.15-7.  
33 (7H, m), 7.39 (2H, d,  $J=6.9$  Hz), 7.48 (2H,  
d,  $J=6.9$  Hz), 8.31 (1H, d,  $J=8.3$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 428  $[M+H]^+$

- 实施例1158 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
15 N( $R^5$ )W- $R^6$ :4-Me<sub>2</sub>NCO-Dihydroindolyl)  
 $^1$ HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.12  
(3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1.85-1.98 (1H, m), 2.95 (3  
H, s), 3.02 (2H, t,  $J=8.4$  Hz), 3.11 (3H, s), 3.  
14 (1H, d,  $J=7.0$  Hz), 3.41 (1H, dt,  $J=9.7$  Hz,  
20 8.4 Hz), 3.76 (1H, dt,  $J=9.7$  Hz, 8.4 Hz), 4.7  
4 (1H, s), 6.96 (1H, d,  $J=7.5$  Hz), 7.14-7.32  
(7H, m), 7.39 (2H, d,  $J=7.0$  Hz), 7.47 (2H, d,  
 $J=7.0$  Hz), 8.39 (1H, d,  $J=7.6$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 456  $[M+H]^+$

- 25 实施例1159 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
N( $R^5$ )W- $R^6$ :Dihydroisoindolyl)  
 $^1$ HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.98 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 1.15  
(3H, d,  $J=6.8$  Hz), 1.82-2.00 (1H, m), 3.11 (1  
H, d,  $J=7.3$  Hz), 4.15 (1H, d,  $J=14.0$  Hz), 4.5

3 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 4.73 (1H, s), 4.79 (1H, d,  $J=16.1\text{ Hz}$ ), 4.99 (1H, d,  $J=16.1\text{ Hz}$ ), 7.07–7.50 (14H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 385  $[M+H]^+$

- 5 実施例1160 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Tetrahydroquinoliny1)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.85 (3H, d,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 0.91 (3H, d,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.70–1.96 (1H, m), 2.59–2.77 (2H, m), 3.44 (1H, dt,  $J=6.4\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ),  
 10 3.66 (1H, d,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3.81 (1H, dt,  $J=6.4\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ), 4.77 (1H, s), 6.90 (1H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 6.99–7.04 (2H, m), 7.12–7.31 (7H, m), 7.33–7.44 (4H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[M+H]^+$

- 15 実施例1161 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Tetrahydroisoquinoliny1)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.96 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.07 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.84 (1H, sep,  $J=6.8\text{ Hz}$ ),  
 2.59–2.72 (2H, m), 3.24–3.38 (2H, m), 3.76  
 20 –3.85 (1H, m), 4.65 (1H, s), 4.67 (1H, d,  $J=17.5\text{ Hz}$ ), 4.96 (1H, d,  $J=17.5\text{ Hz}$ ), 7.09–7.48 (14H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 399  $[M+H]^+$

- 25 実施例2001 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  $R^5$ :H;  $R^6$ :Ph; W:単結合)

$^1\text{HNMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.94 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 0.98 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2.19 (1H, qd,  $J=6.9\text{ Hz}$ ,  $4.5\text{ Hz}$ ), 3.07 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 4.78 (1H, s), 7.09 (1H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.22–7.38 (12H, m), 7.

5.2 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.96 (1H, s)

ESI-MS ( $m/e$ ): 359  $[M+H]^+$

実施例2002 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
 $R^5$ :Me;  $R^6$ :Ph; W:単結合)

- 5  $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.75 (3H, d,  $J=7.0$  Hz), 0.90 (3H, d,  $J=7.0$  Hz), 1.55–1.72 (1H, m), 3.10 (1H, d,  $J=5.0$  Hz), 3.30 (3H, s), 4.80 (1H, s), 6.77 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.02–7.45 (13H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 373  $[M+H]^+$

- 10 実施例2004 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
 $R^5$ :H;  $R^6$ :2-Pyridyl; W:単結合)

- $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.96 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 0.98 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 2.09–2.20 (1H, m), 3.03 (1H, d,  $J=6.2$  Hz), 4.82 (1H, s), 6.99–7.04 (1H, m), 7.14–7.41 (10H, m), 7.69 (1H, t,  $J=7.0$  Hz), 8.23 (2H, d,  $J=7.7$  Hz), 9.83 (1H, s)

ESI-MS ( $m/e$ ): 360  $[M+H]^+$

実施例2005 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
 $R^5$ :Me;  $R^6$ :2-Pyridyl; W:単結合)

- 20  $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.80–0.96 (6H, m), 1.70–1.80 (1H, m), 3.20–3.30 (1H, m), 3.34 (3H, s), 4.83 (1H, s), 7.02–7.06 (1H, m), 7.15–7.47 (12H, m), 8.28–8.29 (1H, brs)

ESI-MS ( $m/e$ ): 374  $[M+H]^+$

- 25 実施例2006 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  
 $R^5$ :Et;  $R^6$ :2-Pyridyl; W:単結合)

- $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.82 (3H, br), 0.92 (3H, d,  $J=6.6$  Hz), 1.12–1.20 (3H, m), 1.70–1.85 (1H, m), 3.06 (1H, d,  $J=6.2$  Hz), 3.80–4.01 (2H, m),

4. 86 (1H, s), 7. 02-7. 08 (1H, m), 7. 16-7. 48  
(12H, m), 8. 31 (1H, br)

ESI-MS (m/e) : 388 [M+H]<sup>+</sup>

実施例2007 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H;

5 R<sup>5</sup>: H; R<sup>6</sup>: 2-Thiazolyl; W: 単結合)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0. 93 (3H, d, J=6. 6Hz), 0. 97  
(3H, d, J=7. 0Hz), 2. 03-2. 11 (1H, m), 3. 16 (1  
H, d, J=5. 4Hz), 4. 79 (1H, s), 6. 92 (1H, d, J=  
3. 7Hz), 7. 17-7. 40 (11H, m)

10 ESI-MS (m/e) : 366 [M+H]<sup>+</sup>

実施例2008 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>:  
H; R<sup>5</sup>: Me; R<sup>6</sup>: 2-Thiazolyl; W: 単結合)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 00 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 07  
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 94 (1H, qd, J=6. 6Hz, 6.  
15 6Hz), 3. 40 (3H, s), 3. 53 (1H, d, J=6. 6Hz), 4.  
64 (1H, s), 7. 03 (1H, d, J=3. 9Hz), 7. 16-7. 4  
5 (10H, m), 7. 53 (1H, d, J=3. 9Hz)

ESI-MS (m/e) : 380 [M+H]<sup>+</sup>

実施例2124 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>:  
20 H; R<sup>5</sup>: H; R<sup>6</sup>: 3-Pyridyl; W: 単結合)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0. 95-0. 99 (6H, m), 2. 17-2.  
24 (1H, m), 3. 14 (1H, d, J=4. 7Hz), 4. 77 (1H,  
s), 7. 22-7. 38 (10H, m), 8. 17 (1H, dd, J=8. 4  
Hz), 8. 32 (1H, d, J=4. 6Hz), 8. 45 (1H, d, J=2.  
25 6Hz), 9. 16 (1H, s)

ESI-MS (m/e) : 360 [M+H]<sup>+</sup>

実施例2126 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H;  
R<sup>5</sup>: H; R<sup>6</sup>: 4-Pyridyl; W: 単結合)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0. 95 (3H, d, J=5. 5Hz), 0. 97

(3H, d,  $J=5.5$  Hz), 2.14–2.24 (1H, m), 3.13 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 4.75 (1H, s), 7.26–7.43 (11H, m), 8.47 (2H, d,  $J=6.3$  Hz), 9.29 (1H, s)

ESI-MS ( $m/e$ ): 360  $[M+H]^+$

5 実施例2128 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  $R^5$ :H;  $R^6$ :4-Me-2-Thiazolyl; W:単結合)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.95 (6H, d,  $J=7.0$  Hz), 2.11–2.20 (1H, m), 2.35 (3H, s), 3.14 (1H, d,  $J=5.1$  Hz), 4.78 (1H, s), 6.51 (1H, s), 7.25–7.37

10 (10H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 380  $[M+H]^+$

実施例2130 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  $R^5$ :H;  $R^6$ :5-Me-2-Thiazolyl; W:単結合)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.88 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 0.97 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 2.00–2.18 (1H, m), 2.33 (3H, s), 3.10 (1H, d,  $J=5.6$  Hz), 4.76 (1H, s), 6.43 (1H, s), 7.12–7.43 (10H, m)

15 ESI-MS ( $m/e$ ): 380  $[M+H]^+$

20 実施例2132 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  $R^5$ :H;  $R^6$ :4,5-Me<sub>2</sub>-2-Thiazolyl; W:単結合)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.94 (6H, d,  $J=6.9$  Hz), 2.11–2.23 (1H, m), 2.24 (3H, s), 2.28 (3H, s), 3.11 (1H, d,  $J=5.0$  Hz), 4.77 (1H, s), 7.14–7.47 (10H, m)

25 ESI-MS ( $m/e$ ): 394  $[M+H]^+$

実施例2134 (Ar:Ph;  $R^1$ :Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H;  $R^5$ :H;  $R^6$ :4-Ph-2-Thiazolyl; W:単結合)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.99 (6H, d,  $J=7.0$  Hz), 2.16–2.27 (1H, m), 3.12 (1H, d,  $J=6.7$  Hz), 4.82 (1

H, s), 6.94 (2H, t, 7.9 Hz), 7.12 (1H, s), 7.16-7.44 (13H, m), 7.83 (2H, d, J=6.7 Hz), 10.22 (1H, br)

ESI-MS (m/e) : 442 [M+H]<sup>+</sup>

5 実施例1068

2-(4-フルオロベンズヒドリルアミノ)-1-(2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル)-3-メチル-1-ブタノン

4-フルオロベンゾニトリル50mg (0.40mmol)を無水トルエン (10ml)に溶解、加熱還流し、フェニルマグネシウムクロライドの1.0Mシクロヘキサン溶液0.45ml (0.45mmol)を滴下した。滴下終了後反応液を2時間加熱還流した。反応液を室温に冷却し無水メタノール0.2mlを加え、室温で30分攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下に濃縮しイミン (収率: 100%)を淡黄色油状物として得た。

得られたイミンの塩化メチレン (5ml)溶液にアミン塩酸塩100mg (0.40mmol)を加え、反応液を室温で一晩攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩化メチレン (5ml)に溶解し、シアノ水素化ホウ素ナトリウム50mg (mmol)及び酢酸0.05mlを加え、反応液を室温で1時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加し、クロロホルムで抽出し、有機層を蒸留水及び飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチルエステル=6:1)により精製し、表題化合物のジアステレオマー混合物101mg (収率: 63%)を無色油状物として得た。

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.89-1.95 (1H, m), 3.04 (2H, dt, J=8.4 Hz, 8.4 Hz), 3.13 (1H, dd, J=6.8 Hz, 6.8 Hz), 3.35-3.50 (1H, m), 3.70-3.81 (1H, m), 4.72 (1H, s), 6.90-7.08 (3H, m), 7.14-7.47 (9H, m), 8.36 (1H, d, J=8.2 Hz)

ESI-MS (m/e) : 403 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11  
(3H, d, J=6.8Hz), 1.89-1.95 (1H, m), 3.04 (2  
5 H, dt, J=8.4Hz, 8.4Hz), 3.13 (1H, dd, J=6.8  
Hz, 6.8Hz), 3.35-3.50 (1H, m), 3.70-3.81 (1  
H, m), 4.72 (1H, s), 6.90-7.08 (3H, m), 7.14  
-7.47 (9H, m), 8.36 (1H, d, J=8.2Hz)

ESI-MS (m/e) : 403 [M+H]<sup>+</sup>

10 実施例1068と同様にして、前記の化合物リストの化合物例番号に対応する  
実施例1027、1029、1035、1037、1039、1041、104  
2、1043、1048、1049、1050、1058、1059、1060、  
1065、1066、1067、1068、1075、1076、1077、1  
081、1082、1087、1089、1090、1091、1095、10  
15 98、1099、1102、1103、1108、1110、1111、111  
2、1113、1114、1115、1116、1117、1118、1119、  
1120、1124、1128、1130、1181、1182、1183、1  
199、1202、1248、1249、1250、1251、1252、12  
53、1254、1255、1274、1275、1276、1277、127  
20 82118、2119及び実施例2120の化合物を得た。以下にこれらの物理  
定数を示す。

実施例1027 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:Me; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H;  
N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Tetrahydroisoquinoliny1)

ジアステレオマーA

25 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.81 (3H, d, J=6.9Hz), 0.87  
(3H, d, J=6.9Hz), 1.26-1.30 (3H, m), 1.68-  
1.77 (1H, m), 2.84-2.92 (2H, m), 3.09 (1H, d,  
J=6.5Hz), 3.30-3.41 (1H, m), 3.49-3.57 (1  
H, m), 3.75-3.80 (1H, m), 4.18 (1H, d, J=16H

z), 4.28 (1H, d,  $J=16\text{ Hz}$ ), 6.81–7.32 (9H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 337  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.90 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 0.94

5 –0.98 (3H, m), 1.32 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.77–  
1.84 (1H, m), 2.67–2.75 (2H, m), 3.26 (1H, d,  
 $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.28–3.35 (1H, m), 3.59–3.74 (2  
H, m), 4.15 (1H, d,  $J=16\text{ Hz}$ ), 4.43 (1H, d,  $J=1$   
6 Hz), 7.07–7.28 (9H, m)

10 ESI-MS ( $m/e$ ): 337  $[M+H]^+$

実施例1029 (Ar:Ph;  $R^1$ : i-Pr;  $R^2$ :H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ :  
H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.72–1.08 (12H, m), 1.79–1.  
90 (2H, m), 2.95 (1H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.00 (2H,  
15 t,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.25 (1H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.28–3.  
37 (1H, m), 3.62–3.71 (1H, m), 7.01–7.31 (9  
H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 351  $[M+H]^+$

実施例1035 (Ar:Ph;  $R^1$ : Cyclohexyl;  $R^2$ :H;  $R^3$ :  
20 i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.78–1.93 (18H, m), 2.91 (1  
H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.99 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.24  
(1H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.30–3.37 (1H, m), 3.62–  
3.68 (1H, m), 7.02–8.35 (9H, m)

25 ESI-MS ( $m/e$ ): 391  $[M+H]^+$

実施例1037 (Ar:Ph;  $R^1$ : Cyclopentyl;  $R^2$ :H;  $R^3$ :  
i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.88 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.02  
(3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.26–2.04 (10H, m), 2.86



-2. 89 (1H, m), 2. 91-3. 06 (2H, m), 3. 20 (1H, d, J=8. 5Hz), 3. 39-3. 48 (1H, m), 3. 62-3. 74 (1H, m), 7. 00-7. 34 (8H, m), 8. 34 (1H, d, J=8. 2Hz)

5 ESI-MS (m/e) : 377 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1039 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:Cyclopropyl;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0. 85 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 01-1. 07 (4H, m), 1. 15 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 22-1. 30 (1H, m), 1. 75-1. 84 (1H, m), 2. 09-2. 33 (1H, m), 2. 64-2. 72 (1H, m), 2. 87-2. 91 (1H, m), 3. 09 (0. 5H, d, J=11Hz), 3. 21-3. 26 (1H, m), 3. 50-3. 68 (1. 5H, m), 7. 01-8. 36 (9H, m)

ESI-MS (m/e) : 349 [M+H]<sup>+</sup>

15 実施例1041 (Ar:Ph;R<sup>1</sup>:2-Me-Ph;R<sup>2</sup>:H;R<sup>3</sup>:i-Pr;R<sup>4</sup>:H;N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 03 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 16 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 90-2. 01 (1H, m), 2. 15 (3H, s), 3. 05 (2H, t, J=8. 5Hz), 3. 15 (1H, d, J=7. 0Hz), 3. 30-3. 50 (1H, m), 3. 73-3. 86 (1H, m), 5. 02 (1H, s), 7. 08-7. 54 (11H, m), 7. 71 (1H, d, J=7. 4Hz), 8. 41 (1H, d, J=7. 8Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

25 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 03 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 18 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 90-2. 01 (1H, m), 2. 39 (3H, s), 3. 08 (2H, t, J=8. 5Hz), 3. 21 (1H, d, J=7. 0Hz), 3. 30-3. 50 (1H, m), 3. 73-3. 86 (1H,

m), 5.04 (1H, s), 7.08–7.54 (11H, m), 7.71 (1H, d, J=7.4Hz), 8.41 (1H, d, J=7.8Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1042 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:3-Me-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.14 (3H, d, J=6.5Hz), 1.18 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91–2.02 (1H, m), 2.32 (3H, s), 3.07 (2H, t, J=8.6Hz), 3.19 (1H, d, J=6.5Hz), 3.44 (1H, dt, J=9.4, 8.6Hz), 3.79 (1H, dt, J=9.4, 8.6Hz), 4.76 (1H, s), 7.00–7.38 (10H, m), 7.44 (1H, d, J=7.4Hz), 7.52 (1H, d, J=7.4Hz), 8.41 (1H, d, J=7.7Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

15 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.14 (3H, d, J=6.5Hz), 1.18 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91–2.02 (1H, m), 2.36 (3H, s), 3.09 (2H, t, J=8.6Hz), 3.20 (1H, d, J=6.5Hz), 3.49 (1H, dt, J=9.4Hz, 8.6Hz), 3.81 (1H, dt, J=9.4Hz, 8.6Hz), 4.76 (1H, s), 7.00–7.38 (10H, m), 7.44 (1H, d, J=7.4Hz), 7.52 (1H, d, J=7.4Hz), 8.41 (1H, d, J=7.7Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

25 実施例1043 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:4-Me-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.04 (3H, d, J=6.5Hz), 1.17 (3H, d, J=6.6Hz), 1.90–2.02 (1H, m), 2.31 (3H, s), 3.05 (2H, t, J=7.9Hz), 3.19 (1H, d, J=

6. 3 Hz), 3. 47 (1H, dt, J=9. 5 Hz, 7. 9 Hz), 3. 73-3. 85 (1H, m), 4. 76 (1H, s), 7. 05-7. 43 (1H, m), 7. 51 (1H, d, J=7. 0 Hz), 8. 40 (1H, d, J=7. 8 Hz)

5 ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 04 (3H, d, J=6. 5 Hz), 1. 17 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 90-2. 02 (1H, m), 2. 37 (3H, s), 3. 07 (2H, t, J=7. 9 Hz), 3. 20 (1H, d, J=6. 3 Hz), 3. 51 (1H, dt, J=9. 5, 7. 9 Hz), 3. 73-3. 85 (1H, m), 4. 76 (1H, s), 7. 05-7. 43 (1H, m), 7. 51 (1H, d, J=7. 0 Hz), 8. 40 (1H, d, J=7. 8 Hz)

ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]<sup>+</sup>

15 実施例1048 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 2-MeO-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0. 99 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 86-1. 99 (1H, m), 3. 02 (2H, t, J=8. 2 Hz), 3. 13 (1H, d, J=6. 6 Hz), 3. 41 (1H, dt, J=10. 3 Hz, 8. 2 Hz), 3. 72-3. 87 (1H, m), 3. 75 (3H, s), 4. 73 (1H, s), 6. 68-6. 80 (1H, m), 6. 97-7. 32 (9H, m), 7. 39 (1H, d, J=7. 4 Hz), 7. 46 (1H, d, J=7. 5 Hz), 8. 36 (1H, d, J=8. 2 Hz)

ESI-MS (m/e) : 415 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 01 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 86-1. 99 (1H, m), 3. 05 (2

H, t,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 3.19 (1H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 3.49 (1H, dt,  $J=10.3\text{ Hz}$ ,  $8.2\text{ Hz}$ ), 3.72-3.87 (1H, m), 3.78 (3H, s), 4.73 (1H, s), 6.68-6.80 (1H, m), 6.97-7.32 (9H, m), 7.39 (1H, d,  $J=7.4$   
 5 Hz), 7.46 (1H, d,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 415  $[M+H]^+$

実施例1049 (Ar: Ph;  $R^1$ : 3-MeO-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

10 ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.97 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.13 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.87-1.97 (1H, m), 3.02 (2H, t,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 3.10 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.37-3.50 (1H, m), 3.68-3.82 (1H, m), 3.59 (3H,  
 15 s), 5.16 (1H, s), 6.72 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 6.85-7.50 (10H, m), 7.62 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 8.37 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ).

ESI-MS ( $m/e$ ): 415  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

20  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.97 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.13 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.87-1.97 (1H, m), 3.02 (2H, t,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 3.13 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.37-3.50 (1H, m), 3.68-3.82 (1H, m), 3.73 (3H, s), 5.27 (1H, s), 6.79 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 6.8  
 25 5-7.50 (10H, m), 7.82 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 8.40 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 415  $[M+H]^+$

実施例1050 (Ar: Ph;  $R^1$ : 4-MeO-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

## ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.8Hz), 1.11 (3H, d, J=5.6Hz), 1.88-1.94 (1H, m), 3.03 (2H, dt, J=8.3Hz, 8.3Hz), 3.15 (1H, brs), 3.35-3.51 (1H, m), 3.76 (1H, dt, J=8.3Hz, 8.3Hz), 3.70 (3H, s), 4.70 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=8.8Hz), 6.85 (1H, d, J=8.8Hz), 7.04 (1H, t, J=7.4Hz), 7.15-7.47 (10H, m), 8.36 (1H, d, J=7.9Hz)
- 10 ESI-MS (m/e): 415 [M+H]<sup>+</sup>

## ジアステレオマーB

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.8Hz), 1.11 (3H, d, J=5.6Hz), 1.88-1.94 (1H, m), 3.03 (2H, dt, J=8.3Hz, 8.3Hz), 3.15 (1H, brs), 3.35-3.51 (1H, m), 3.76 (1H, dt, J=8.3Hz, 8.3Hz), 3.79 (3H, s), 4.70 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=8.8Hz), 6.85 (1H, d, J=8.8Hz), 7.04 (1H, t, J=7.4Hz), 7.15-7.47 (10H, m), 8.36 (1H, d, J=7.9Hz)
- 15

- 20 ESI-MS (m/e): 415 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1058 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 4-PhCOO-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

## ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.9Hz), 1.12 (3H, d, J=6.9Hz), 1.88-1.98 (1H, m), 3.04 (2H, t, J=8.2Hz), 3.19 (1H, d, J=7.0Hz), 3.35-3.50 (1H, m), 3.70-3.84 (1H, m), 4.79 (1H, s), 7.02-7.65 (13H, m), 8.10 (2H, d, J=8.7Hz), 8.17 (2H, t, J=7.0Hz), 8.37 (1H, d, J=7.
- 25

9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 505 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.02 (3H, d, J=6.9 Hz), 1.12  
 5 (3H, d, J=6.9 Hz), 1.88-1.98 (1H, m), 3.01 (2  
 H, t, J=8.2 Hz), 3.16 (1H, d, J=7.0 Hz), 3.35  
 -3.50 (1H, m), 3.70-3.84 (1H, m), 4.78 (1H,  
 s), 7.02-7.65 (13H, m), 8.10 (2H, d, J=8.7 Hz),  
 8.17 (2H, t, J=7.0 Hz), 8.37 (1H, d, J=7.  
 10 9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 505 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1059 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeNHCOCH<sub>2</sub>O-Ph; R<sup>2</sup>:  
 H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl  
 1)

15 ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.11  
 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.89-1.94 (1H, m), 2.88-  
 2.92 (3H, m), 3.04 (2H, dt, J=7.8 Hz, 7.8 Hz),  
 3.12-3.16 (1H, m), 3.36-3.51 (1H, m), 3.71  
 20 -3.81 (1H, m), 4.41 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.  
 53-6.58 (1H, brs), 6.79 (1H, d, J=8.8 Hz), 6.  
 86 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.05 (1H, t, J=7.4 Hz),  
 7.16-7.47 (9H, m), 8.35 (1H, d, J=8.2 Hz)

ESI-MS (m/e) : 472 [M+H]<sup>+</sup>

25 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.11  
 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.89-1.94 (1H, m), 2.88-  
 2.92 (3H, m), 3.04 (2H, dt, J=7.8 Hz, 7.8 Hz),  
 3.12-3.16 (1H, m), 3.36-3.51 (1H, m), 3.71

-3.81 (1H, m), 4.47 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.53-6.58 (1H, brs), 6.79 (1H, d, J=8.8Hz), 6.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.05 (1H, t, J=7.4Hz), 7.16-7.47 (9H, m), 8.35 (1H, d, J=8.2Hz)

5 ESI-MS (m/e) : 472 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1060 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:4-n-PrNHCOCH<sub>2</sub>O-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

10 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.88-1.01 (6H, m), 1.10 (3H, d, J=6.6Hz), 1.48-1.62 (2H, m), 1.89-1.95 (1H, m), 3.03 (2H, dt, J=7.9Hz, 7.9Hz), 3.10-3.15 (1H, brs), 3.23-3.34 (2H, m), 3.36-3.52 (1H, m), 3.71-3.84 (1H, m), 4.41 (2H, s),  
15 4.71 (1H, s), 6.51-6.60 (1H, brs), 6.79 (1H, d, J=8.8Hz), 6.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.05 (1H, t, J=7.3Hz), 7.16-7.47 (9H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 500 [M+H]<sup>+</sup>

20 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.88-1.01 (6H, m), 1.11 (3H, d, J=6.7Hz), 1.48-1.62 (2H, m), 1.89-1.95 (1H, m), 3.03 (2H, dt, J=7.9Hz, 7.9Hz), 3.10-3.15 (1H, brs), 3.23-3.34 (2H, m), 3.36-  
25 3.52 (1H, m), 3.71-3.84 (1H, m), 4.47 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.51-6.60 (1H, brs), 6.79 (1H, d, J=8.8Hz), 6.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.05 (1H, t, J=7.3Hz), 7.16-7.47 (9H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 500 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1065 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:4-CF<sub>3</sub>-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- 5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.01 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11 (3H, d, J=6.7Hz), 1.89-1.97 (1H, m), 3.04 (2H, dt, J=8.9Hz, 8.9Hz), 3.11 (1H, d, J=6.3Hz), 3.33-3.50 (1H, m), 3.71-3.86 (1H, m), 4.79 (1H, s), 7.06-7.61 (12H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)
- 10

ESI-MS (m/e) : 453 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.03 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12 (3H, d, J=6.7Hz), 1.89-1.97 (1H, m), 3.04 (2H, dt, J=8.9Hz, 8.9Hz), 3.15 (1H, d, J=6.6Hz), 3.33-3.50 (1H, m), 3.71-3.86 (1H, m), 4.80 (1H, s), 7.06-7.61 (12H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)
- 15

ESI-MS (m/e) : 453 [M+H]<sup>+</sup>

- 20 実施例1066 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:2-F-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11 (3H, d, J=6.9Hz), 1.90-1.96 (1H, m), 3.00-3.88 (3H, m), 3.35-3.88 (2H, m), 5.12 (1H, s), 6.97-8.37 (13H, m)
- 25

ESI-MS (m/e) : 403 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11



(3H, d,  $J=6.9$  Hz), 1.90–1.96 (1H, m), 3.00–3.88 (3H, m), 3.35–3.88 (2H, m), 5.14 (1H, s), 6.97–8.37 (13H, m)

ESI-MS ( $m/e$ ): 403  $[M+H]^+$

- 5 実施例1067 (Ar:Ph;  $R^1$ :3-F-Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

$^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 0.99–1.03 (3H, m), 1.12 (3H, d,  $J=6.9$  Hz), 1.90–1.94 (1H, m), 3.05 (2H, d t,  $J=9.0$  Hz, 9.0 Hz), 3.14 (1H, dd,  $J=6.6$  Hz, 6.6 Hz), 3.33–3.53 (1H, m), 3.70–3.82 (1H, m), 4.74 (1H, s), 6.81–7.46 (12H, m), 8.36 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 403  $[M+H]^+$

- 15 ジアステレオマーB

$^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 0.99–1.03 (3H, m), 1.12 (3H, d,  $J=6.9$  Hz), 1.90–1.94 (1H, m), 3.05 (2H, d t,  $J=9.0$  Hz, 9.0 Hz), 3.14 (1H, dd,  $J=6.6$  Hz, 6.6 Hz), 3.33–3.53 (1H, m), 3.70–3.82 (1H, m), 4.73 (1H, s), 6.81–7.46 (12H, m), 8.36 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 403  $[M+H]^+$

実施例1075 (Ar:Ph;  $R^1$ :3-MeOCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Dihydroindolyl)

- 25 ジアステレオマーA

$^1$ HNMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.14 (3H, d,  $J=6.8$  Hz), 1.88–2.01 (1H, m), 3.02 (2H, t,  $J=8.2$  Hz), 3.15 (1H, d,  $J=6.2$  Hz), 3.38 (3H, s), 3.38–3.48 (1H, m), 3.70–3.76 (1H, m),

4. 42 (2H, s), 4. 77 (1H, s), 7. 02-7. 50 (12H, m), 8. 38 (1H, d, J=7. 6Hz)

ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- 5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 00 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 88-2. 01 (1H, m), 3. 02 (2H, t, J=8. 2Hz), 3. 15 (1H, d, J=6. 2Hz), 3. 35 (3H, s), 3. 38-3. 48 (1H, m), 3. 70-3. 76 (1H, m), 4. 39 (2H, s), 4. 77 (1H, s), 7. 02-7. 50 (12H, m), 8. 38 (1H, d, J=7. 6Hz)
- 10

ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1076 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:4-HOCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- 15 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 00 (3H, d, J=7. 0Hz), 1. 12 (3H, d, J=7. 0Hz), 1. 87-1. 96 (1H, m), 3. 04 (2H, t, J=8. 4Hz), 3. 15 (1H, d, J=6. 6Hz), 3. 47 (1H, dt, J=10. 0Hz, 8. 4Hz), 3. 77 (1H, dt, J=9. 4Hz, 8. 9Hz), 4. 67 (2H, s), 4. 75 (1H, s), 7. 05 (1H, t, J=7. 7Hz), 7. 13-7. 33 (7H, m), 7. 38 (2H, d, J=6. 8Hz), 7. 49 (2H, d, J=7. 9Hz), 8. 36 (1H, d, J=8. 2Hz)
- 20

ESI-MS (m/e) : 415 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- 25 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 00 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 89-2. 05 (1H, m), 3. 02 (2H, t, J=8. 2Hz), 3. 15 (1H, d, J=6. 5Hz), 3. 41 (1H, dt, J=9. 8Hz, 8. 2Hz), 3. 75 (1H, dt, J=9. 2Hz, 9. 0Hz), 4. 59 (2H, s), 4. 76 (1H, s), 7. 0

5 (1H, t,  $J=7.4$  Hz), 7.19–7.34 (7H, m), 7.39  
 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.46 (2H, d,  $J=7.2$  Hz), 8.  
 35 (1H, d,  $J=8.2$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 415  $[M+H]^+$

- 5 実施例1077 (Ar: Ph;  $R^1$ : 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ :  
 i-Pr;  $R^4$ : H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=6.5$  Hz), 1.11  
 (3H, d,  $J=7.0$  Hz), 1.85–1.95 (1H, m), 3.10 (2  
 10 H, t,  $J=8.9$  Hz), 3.15 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 3.41  
 (3H, s), 3.44 (1H, td,  $J=9.1$  Hz, 9.1 Hz), 3.7  
 5 (1H, td,  $J=9.1$  Hz, 9.1 Hz), 4.42 (2H, s), 4.  
 74 (1H, s), 7.04–7.28 (8H, m), 7.37 (2H, d,  $J$   
 =7.7 Hz), 7.47 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.36 (1H, d,  
 15  $J=8.2$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 429  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.5$  Hz), 1.12  
 (3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1.85–1.95 (1H, m), 3.02 (2  
 20 H, t,  $J=8.8$  Hz), 3.15 (1H, d,  $J=6.2$  Hz), 3.31  
 (3H, s), 3.39 (1H, td,  $J=8.8$  Hz, 8.8 Hz), 3.7  
 4 (1H, td,  $J=8.8$  Hz, 8.8 Hz), 4.37 (2H, s), 4.  
 75 (1H, s), 7.04 (1H, t,  $J=7.5$  Hz), 7.17–7.3  
 0 (7H, m), 7.38 (2H, d,  $J=8.4$  Hz), 7.47 (2H, d,  
 25  $J=6.9$  Hz), 8.35 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 429  $[M+H]^+$

- 実施例1081 (Ar: Ph;  $R^1$ : 4-HO (Me) CH-Ph;  $R^2$ : H;  
 $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; N ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.99 (3H, d, J=6.5Hz), 1.12  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.41 (3H, d, J=6.7Hz), 1.  
 85-1.95 (1H, m), 3.02 (2H, td, J=8.3Hz, 3.2  
 Hz), 3.14 (1H, d, J=6.5Hz), 3.39-3.44 (1H,  
 5 m), 3.73-3.76 (1H, m), 4.74 (1H, s), 4.79 (1  
 H, q, J=6.7Hz), 7.02-7.48 (13H, m), 8.35 (1  
 H, dd, J=7.9Hz, 4.0Hz)

ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

10 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.99 (3H, d, J=6.5Hz), 1.12  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.48 (3H, d, J=6.1Hz), 1.  
 85-1.95 (1H, m), 3.02 (2H, td, J=8.3Hz, 3.2  
 Hz), 3.14 (1H, d, J=6.5Hz), 3.39-3.44 (1H,  
 m), 3.73-3.76 (1H, m), 4.74 (1H, s), 4.87 (1  
 15 H, q, J=6.1Hz), 7.02-7.48 (13H, m), 8.35 (1  
 H, dd, J=7.9Hz, 4.0Hz)

ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1082 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeO (Me) CH-Ph; R<sup>2</sup>:  
 H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindol  
 20 yl )

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.99 (3H, d, J=6.5Hz), 1.12  
 (3H, d, J=6.5Hz), 1.35 (3H, d, J=6.6Hz), 1.  
 89-1.95 (1H, m), 3.01 (2H, dd, J=14.2Hz, 8.  
 25 2Hz), 3.10-3.15 (4H, m), 3.29-3.45 (1H, m),  
 3.68-3.78 (1H, m), 4.21 (1H, q, J=6.4Hz), 4.  
 73 (1H, s), 7.01-7.50 (12H, m), 8.36 (1H, d,  
 J=8.3Hz)

ESI-MS (m/e) : 443 [M+H]<sup>+</sup>

## ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.12 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.41 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.89-1.95 (1H, m), 3.01 (2H, dd, J=14.2 Hz, 8.2 Hz), 3.15 (4H, s), 3.29-3.45 (1H, m), 3.68-3.78 (1H, m), 4.27 (1H, q, J=6.4 Hz), 4.73 (1H, s), 7.01-7.50 (12H, m), 8.36 (1H, d, J=8.3 Hz)

ESI-MS (m/e): 443 [M+H]<sup>+</sup>

10 実施例1087 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeSO<sub>2</sub> (Me) NCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

## ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=7.0 Hz), 1.11 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.87-1.98 (1H, m), 2.76 (3H, s), 2.84 (3H, s), 3.03 (2H, t, J=8.5 Hz), 3.12 (1H, d, J=6.6 Hz), 3.42 (1H, dt, J=9.8 Hz, 8.2 Hz), 3.76 (1H, dt, J=9.1 Hz, 9.0 Hz), 4.28 (2H, s), 4.74 (1H, s), 7.05 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.14-7.38 (7H, m), 7.40 (2H, d, J=7.3 Hz), 7.47 (2H, d, J=7.6 Hz), 8.35 (1H, d, J=8.2 Hz)

ESI-MS (m/e): 506 [M+H]<sup>+</sup>

## ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.11 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.85-1.97 (1H, m), 2.70 (3H, s), 2.79 (3H, s), 3.03 (2H, t, J=8.5 Hz), 3.14 (1H, d, J=6.6 Hz), 3.41 (1H, dt, J=9.5 Hz, 8.5 Hz), 3.75 (1H, dt, J=9.5 Hz, 9.0 Hz), 4.22 (2H, s), 4.74 (1H, s), 7.04 (1H, t, J=7.2 Hz),

7. 17-7. 33 (7H, m), 7. 40 (2H, d, J=7. 9Hz), 7. 46 (2H, d, J=7. 2Hz), 8. 34 (1H, d, J=8. 2Hz)

ESI-MS (m/e) : 506 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1089 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 4-PhCO-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i  
5 -Pr; R<sup>4</sup>: H; N (R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 02 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11  
(3H, d, J=6. 5Hz), 1. 89-2. 01 (1H, m), 3. 04 (2  
H, t, J=8. 2Hz), 3. 15 (1H, d, J=6. 6Hz), 3. 37  
10 -3. 51 (1H, m), 3. 73-3. 83 (1H, m), 4. 83 (1H,  
s), 7. 06 (1H, t, J=7. 0Hz), 7. 17-7. 35 (5H, m),  
7. 41-7. 65 (7H, m), 7. 68-7. 82 (4H, m), 8. 37  
(1H, d, J=7. 8Hz)

ESI-MS (m/e) : 489 [M+H]<sup>+</sup>

15 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 02 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 14  
(3H, d, J=6. 5Hz), 1. 89-2. 01 (1H, m), 3. 06 (2  
H, t, J=8. 2Hz), 3. 18 (1H, d, J=6. 6Hz), 3. 37  
-3. 51 (1H, m), 3. 73-3. 83 (1H, m), 4. 84 (1H,  
20 s), 7. 06 (1H, t, J=7. 0Hz), 7. 17-7. 35 (5H, m),  
7. 41-7. 65 (7H, m), 7. 68-7. 82 (4H, m), 8. 37  
(1H, d, J=7. 8Hz)

ESI-MS (m/e) : 489 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1090 (Ar: Ph; R<sup>1</sup>: 4-HO<sub>2</sub>C-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i  
25 -Pr; R<sup>4</sup>: H; N (R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 02 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 12  
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 90-2. 10 (1H, m), 3. 04 (2  
H, t, J=8. 3Hz), 3. 12 (1H, d, J=6. 4Hz), 3. 39

-3.49 (1H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.77 (1H, s) 7.06-8.39 (13H, m)

ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.02 (3H, d, J=6.9Hz), 1.17 (3H, d, J=6.9Hz), 1.90-2.10 (1H, m), 3.04 (2H, t, J=8.3Hz), 3.17 (1H, d, J=6.6Hz), 3.39-3.49 (1H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.80 (1H, s), 7.06-8.39 (13H, m)

10 ESI-MS (m/e) : 429 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1091 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeO<sub>2</sub>C-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7Hz), 1.10-1.14 (3H, m), 1.89-1.96 (1H, m), 3.02 (2H, t, J=8.4Hz), 3.10 (1H, d, J=6.3Hz), 3.34-3.48 (1H, m), 3.73-3.78 (1H, m), 3.86 (3H, s), 4.79 (1H, s), 7.05 (1H, t, J=7.3Hz), 7.17-7.60 (9H, m), 7.92-8.00 (2H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 443 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7Hz), 1.10-1.14 (3H, m), 1.89-1.96 (1H, m), 3.02 (2H, t, J=8.4Hz), 3.15 (1H, d, J=6.6Hz), 3.34-3.48 (1H, m), 3.73-3.78 (1H, m), 3.90 (3H, s), 4.80 (1H, s), 7.05 (1H, t, J=7.3Hz), 7.17-7.60 (9H, m), 7.92-8.00 (2H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 443 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1095 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: 4-Me<sub>2</sub>NCO-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:  
i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=5.6Hz), 1.12  
5 (3H, d, J=6.2Hz), 1.90-1.95 (1H, m), 2.91-  
3.17 (9H, m), 3.39-3.43 (1H, m), 3.74-3.77  
(1H, m), 4.76 (1H, s), 7.02-7.54 (12H, m), 8.  
35 (1H, d, J=7.8Hz)

ESI-MS (m/e) : 456 [M+H]<sup>+</sup>

10 実施例1098 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>: 3-I-4-HO-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:  
i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12  
(3H, d, J=6.6Hz), 1.87-1.98 (1H, m), 3.03 (2  
15 H, t, J=8.4Hz), 3.12 (1H, d, J=6.6Hz), 3.36  
(1H, dt, J=9.9Hz, 8.2Hz), 3.72 (1H, dt, J=9.  
9Hz, 8.2Hz), 4.63 (1H, s), 6.85 (1H, d, J=8.  
6Hz), 7.05 (1H, t, J=7.7Hz), 7.17-7.42 (8H,  
m), 7.68 (1H, d, J=2.4Hz), 8.36 (1H, d, J=7.  
20 9Hz)

ESI-MS (m/e) : 527 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.01 (3H, d, J=6.5Hz), 1.10  
(3H, d, J=6.5Hz), 1.86-1.97 (1H, m), 3.04-  
25 3.15 (3H, m), 3.53 (1H, dt, J=9.9Hz, 8.2Hz),  
3.81 (1H, dt, J=9.9Hz, 8.2Hz), 4.64 (1H, s),  
6.93 (1H, d, J=7.7Hz), 7.06 (1H, t, J=7.7Hz),  
7.14-7.43 (8H, m), 7.80 (1H, d, J=2.0Hz), 8.  
36 (1H, d, J=7.9Hz)



ESI-MS (m/e) : 527 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1099 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:3-I-4-MeO-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- 5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12 (3H, d, J=6.6Hz), 1.87-1.98 (1H, m), 3.01 (2H, t, J=8.4Hz), 3.11 (1H, d, J=6.6Hz), 3.36 (1H, dt, J=9.9Hz, 8.2Hz), 3.69-3.78 (1H, m), 3.79 (3H, s), 4.65 (1H, s), 6.69 (1H, d, J=8.6Hz), 7.05 (1H, t, J=7.7Hz), 7.17-7.36 (6H, m), 7.43 (2H, d, J=7.3Hz), 7.79 (1H, d, J=2.4Hz), 8.35 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 541 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- 15 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.01 (3H, d, J=6.5Hz), 1.10 (3H, d, J=6.5Hz), 1.86-1.97 (1H, m), 3.02-3.16 (3H, m), 3.49-3.60 (1H, m), 3.77-3.85 (1H, m), 3.86 (3H, s), 4.64 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=7.7Hz), 7.06 (1H, t, J=7.7Hz), 7.14-7.43 (8H, m), 7.91 (1H, d, J=2.0Hz), 8.36 (1H, d, J=7.9Hz)

ESI-MS (m/e) : 541 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1102 (Ar:Ph; R<sup>1</sup>:3-HOCH<sub>2</sub>-4-F-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

25 1)

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.98-1.02 (3H, m), 1.09-1.13 (3H, m), 1.90-1.96 (1H, m), 3.00-3.07 (2H, m), 3.09-3.15 (1H, m), 3.35-3.55 (1H, m),

3. 75 (1H, dt,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $9.0\text{ Hz}$ ), 4. 66 (1H, s),  
 4. 73 (2H, s), 6. 90–7. 46 (11H, m), 8. 33–8. 3  
 7 (1H, dd,  $J=8.1\text{ Hz}$ ,  $3.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ) : 433  $[M+H]^+$

5 ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 0. 98–1. 02 (3H, m), 1. 09–1.  
 13 (3H, m), 1. 90–1. 96 (1H, m), 3. 00–3. 07 (2  
 H, m), 3. 09–3. 15 (1H, m), 3. 35–3. 55 (1H, m),  
 3. 80 (1H, dt,  $J=8.2\text{ Hz}$ ,  $8.2\text{ Hz}$ ), 4. 66 (1H, s),  
 10 4. 73 (2H, s), 6. 90–7. 46 (11H, m), 8. 33–8. 3  
 7 (1H, dd,  $J=8.1\text{ Hz}$ ,  $3.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ) : 433  $[M+H]^+$

実施例1103 (Ar:Ph;  $R^1$ : 3-MeOCH<sub>2</sub>-4-F-Ph;  $R^2$ :  
 H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindoly  
 15 1 )

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 0. 99 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1. 10  
 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1. 86–1. 95 (1H, m), 2. 99–  
 3. 14 (3H, m), 3. 36 (3H, s), 3. 33–3. 56 (1H, m),  
 20 3. 69–3. 84 (1H, m), 4. 44 (2H, s), 4. 72 (1H, s),  
 6. 89–7. 51 (11H, m), 8. 36 (1H, dd,  $J=8.0\text{ Hz}$ ,  
 2. 7Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ) : 447  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

25  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 1. 00 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1. 12  
 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1. 86–1. 95 (1H, m), 2. 99–  
 3. 14 (3H, m), 3. 38 (3H, s), 3. 33–3. 56 (1H, m),  
 3. 69–3. 84 (1H, m), 4. 47 (2H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 4.  
 73 (1H, s), 6. 89–7. 51 (11H, m), 8. 36 (1H, dd,

$J=8.0\text{ Hz}, 2.7\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ) : 447  $[M+H]^+$

実施例1108 (Ar:Ph;  $R^1$ :3,4- $F_2$ -Ph;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Dihydroindolyl)

5 ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.11 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.93 (1H, sep,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 2.99-3.13 (3H, m), 3.37 (1H, dt,  $J=9.3\text{ Hz}, 8.2\text{ Hz}$ ), 3.73 (1H, dt,  $J=9.3\text{ Hz}, 8.2\text{ Hz}$ ), 4.69 (10 H, s), 7.01-7.44 (11H, m), 8.34 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ) : 421  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.02 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.09 (15 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.93 (1H, sep,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 2.99-3.13 (3H, m), 3.52 (1H, dt,  $J=9.7\text{ Hz}, 8.2\text{ Hz}$ ), 3.85 (1H, dt,  $J=9.7\text{ Hz}, 8.2\text{ Hz}$ ), 4.68 (1 H, s), 7.01-7.44 (11H, m), 8.34 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ )

20 ESI-MS ( $m/e$ ) : 421  $[M+H]^+$

実施例1110 (Ar:4-F-Ph;  $R^1$ :4-Piperadiny1;  $R^2$ :H;  $R^3$ :i-Pr;  $R^4$ :H; N( $R^5$ )W- $R^6$ :Dihydroindolyl)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.95 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.01 (25 (3H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.14-2.28 (2H, m), 1.50-1.62 (1H, m), 1.70-1.91 (2H, m), 2.15-2.23 (1H, m), 2.44 (1H, dt,  $J=2.7\text{ Hz}, 12.3\text{ Hz}$ ), 2.57 (1H, dt,  $J=2.7\text{ Hz}, 12.3\text{ Hz}$ ), 2.79-3.01 (4 H, m), 3.11 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 3.19-3.32 (2

H, m), 3.70-3.79 (1H, m), 6.80 (2H, t, J=8.3 Hz), 6.97 (1H, t, J=7.4 Hz), 7.11-7.25 (4H, m), 8.10 (1H, d, J=8.3 Hz)

ESI-MS (m/e) 410 [M+H]<sup>+</sup>

- 5 実施例1111 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: N-PhCH<sub>2</sub>-4-Piperadiny1; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.06 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.18-1.27 (2H, m), 1.40-1.58 (2H, m), 1.72-2.03 (2H, m), 2.15-2.30 (2H, m), 2.83-3.04 (4H, m), 3.26-3.34 (1H, m), 3.35 (1H, d, J=7.2 Hz), 3.52 (2H, s), 3.79 (1H, dt, J=6.1 Hz, 9.8 Hz), 6.81-6.90 (2H, m), 7.01-7.06 (1H, m), 7.10-7.22 (5H, m), 7.26-7.37 (5H, m), 8.13 (1H, d, J=7.7 Hz)
- 10 15

ESI-MS (m/e) 500 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1112 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: N-MeSO<sub>2</sub>-4-Piperadiny1; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.18-1.31 (2H, m), 1.37-1.63 (2H, m), 1.78-1.90 (1H, m), 2.30-2.51 (2H, m), 2.62 (1H, dt, J=2.7 Hz, 11.7 Hz), 2.74 (3H, s), 2.80-3.04 (3H, m), 3.19-3.39 (2H, m), 3.64-3.80 (2H, m), 3.87 (1H, d, J=11.7 Hz), 6.82 (2H, t, J=8.4 Hz), 6.98 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.07-7.17 (4H, m), 8.06 (1H, d, J=7.9 Hz)
- 20 25

ESI-MS (m/e) 488 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1113 (Ar: 2-Pyridyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.98 (3H, d, J=6.8Hz), 1.11  
 5 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91-2.03 (1H, m), 3.04 (2  
 H, t, J=8.3Hz), 3.16 (1H, d, J=6.8Hz), 3.47  
 (1H, dt, J=9.7Hz, 9.3Hz), 3.73-3.85 (1H, m),  
 4.89 (1H, s), 6.99-7.08 (1H, m), 7.12-7.56  
 (9H, m), 7.67-7.79 (1H, m), 8.33 (1H, d, J=7.  
 10 9Hz), 8.50 (1H, d, J=8.3Hz)

ESI-MS (m/e): 386 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.98 (3H, d, J=6.8Hz), 1.13  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91-2.03 (1H, m), 3.07 (2  
 15 H, t, J=8.3Hz), 3.16 (1H, d, J=6.8Hz), 3.66  
 (1H, dt, J=9.7Hz, 9.3Hz), 3.73-3.85 (1H, m),  
 4.92 (1H, s), 6.99-7.08 (1H, m), 7.12-7.56  
 (9H, m), 7.67-7.79 (1H, m), 8.35 (1H, d, J=7.  
 9Hz), 8.50 (1H, d, J=8.3Hz)

20 ESI-MS (m/e): 386 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1114 (Ar: 3-Pyridyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.02 (3H, d, J=6.8Hz), 1.09  
 25 (3H, d, J=6.7Hz), 1.87-1.98 (1H, m), 3.06 (2  
 H, t, J=8.0Hz), 3.14 (1H, d, J=6.3Hz), 3.33  
 (1H, dt, J=10.1Hz, 8.3Hz), 3.74 (1H, dt, J=  
 10.1Hz, 8.3Hz), 4.82 (1H, s), 7.05 (1H, t, J  
 =7.4Hz), 7.16-7.47 (8H, m), 7.92 (1H, d, J=

7. 3 Hz), 8. 33 (1H, d, J=7. 9 Hz), 8. 51 (1H, d, J=2. 8 Hz), 8. 70 (1H, d, J=5. 7 Hz)

ESI-MS (m/e) : 386 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- 5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 02 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 88-2. 01 (1H, m), 3. 02-3. 13 (3H, m), 3. 52 (1H, dt, J=10. 0 Hz, 8. 6 Hz), 3. 81 (1H, dt, J=10. 0 Hz, 8. 6 Hz), 4. 77 (1H, s), 7. 05 (1H, t, J=7. 3 Hz), 7. 16-7. 47 (8H, m), 7. 92 (1H, 7, J=7. 3 Hz), 8. 33 (1H, d, J=7. 9 Hz), 8. 46 (1H, d, J=2. 8 Hz), 8. 70 (1H, d, J=5. 7 Hz)
- 10 ESI-MS (m/e) : 386 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1115 (Ar : 4-Pyridyl; R<sup>1</sup> : Ph; R<sup>2</sup> : H; R<sup>3</sup> : i-Pr; R<sup>4</sup> : H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup> : Dihydroindolyl)

- 15 ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 00 (3H, d, J=6. 8 Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 87-1. 98 (1H, m), 3. 03 (2H, t, J=8. 3 Hz), 3. 12 (1H, d, J=6. 3 Hz), 3. 36 (1H, dt, J=10. 1 Hz, 8. 3 Hz), 3. 74 (1H, dt, J=10. 1 Hz, 8. 3 Hz), 4. 73 (1H, s), 7. 05 (1H, t, J=7. 4 Hz), 7. 18-7. 36 (7H, m), 7. 42 (2H, d, J=7. 6 Hz), 8. 34 (1H, d, J=7. 9 Hz), 8. 48 (2H, d, J=6. 0 Hz)
- 20

ESI-MS (m/e) : 386 [M+H]<sup>+</sup>

- 25 ジアステレオマーB

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 04 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 88-2. 01 (1H, m), 3. 07 (2H, t, J=8. 6 Hz), 3. 11 (1H, d, J=6. 3 Hz), 3. 50 (1H, dt, J=10. 0 Hz, 8. 6 Hz), 3. 83 (1H, dt, J=

10. 0 Hz, 8. 6 Hz), 4. 70 (1H, s), 7. 06 (1H, t, J = 7. 3 Hz), 7. 19-7. 37 (7H, m), 7. 44 (2H, d, J = 5. 9 Hz), 8. 35 (1H, d, J = 7. 9 Hz), 8. 55 (2H, d, J = 5. 7 Hz)

5 ESI-MS (m/e) : 386 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1116 (Ar: 3-F-4-Pyridyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)  
ジステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 01 (3H, d, J = 6. 5 Hz), 1. 11  
10 (3H, d, J = 6. 5 Hz), 1. 96 (1H, qd, J = 7. 0 Hz, 7. 0 Hz), 3. 07-3. 13 (3H, m), 3. 57 (1H, td, J = 8. 9 Hz, 8. 9 Hz), 3. 88 (1H, td, J = 8. 9 Hz, 8. 9 Hz), 4. 72 (1H, s), 7. 06-7. 35 (10H, m), 8. 14 (1H, d, J = 4. 9 Hz), 8. 33 (1H, d, J = 8. 2 Hz)

15 ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]<sup>+</sup>

ジステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1. 01 (3H, d, J = 6. 5 Hz), 1. 11  
20 (3H, d, J = 6. 5 Hz), 1. 93 (1H, qd, J = 6. 5 Hz, 6. 5 Hz), 3. 03 (2H, t, J = 8. 8 Hz), 3. 11 (1H, d, J = 6. 5 Hz), 3. 33 (1H, td, J = 8. 8 Hz, 8. 8 Hz), 3. 74 (1H, td, J = 8. 8 Hz, 8. 8 Hz), 4. 76 (1H, s), 7. 04-7. 09 (2H, m), 7. 18-7. 36 (6H, m), 7. 41 (2H, d, J = 6. 2 Hz), 8. 07 (1H, d, J = 4. 8 Hz), 8. 33 (1H, d, J = 8. 2 Hz)

25 ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1117 (Ar: 3-Me-4-Pyridyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)  
1)

ジステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=4.2\text{ Hz}$ ), 1.93 (1H, qd,  $J=6.2\text{ Hz}$ , 6.2 Hz), 2.49 (3H, s), 3.00–3.12 (3H, m), 3.32–3.41 (1H, m), 3.70–3.87 (1H, m), 4.66 (1H, s), 7.06–7.44 (10H, m), 8.34–8.43 (2H, m)  
 5 ESI-MS ( $m/e$ ): 400  $[\text{M}+\text{H}]^+$

## ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.07 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.12 (3H, d,  $J=4.1\text{ Hz}$ ), 1.93 (1H, qd,  $J=6.2\text{ Hz}$ , 6.2 Hz), 2.53 (3H, s), 3.00–3.12 (3H, m), 3.47–3.56 (1H, m), 3.70–3.87 (1H, m), 4.68 (1H, s), 7.06–7.44 (10H, m), 8.34–8.43 (2H, m)  
 10 ESI-MS ( $m/e$ ): 400  $[\text{M}+\text{H}]^+$

実施例1118 (Ar: 3-MeOCH<sub>2</sub>-4-Pyridyl; R<sup>1</sup>: Ph;  
 15 R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

## ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.04 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.89–1.99 (1H, m), 3.05–3.10 (3H, m), 3.46 (3H, s), 3.54 (1H, dt,  $J=8.9\text{ Hz}$ , 8.9 Hz), 3.82 (1H, dt,  $J=9.1\text{ Hz}$ , 9.1 Hz), 4.55 (2H, s), 4.71 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.17–7.45 (8H, m), 7.53 (1H, s), 8.34 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 8.50 (1H, d,  $J=5.3\text{ Hz}$ )  
 20 ESI-MS ( $m/e$ ): 430  $[\text{M}+\text{H}]^+$

## ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.12 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.87–1.98 (1H, m), 3.03 (2H, t,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.11 (1H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 3.



3.5 (1H, dt,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $8.8\text{ Hz}$ ), 3.43 (3H, s), 3.74 (1H, dt,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $8.8\text{ Hz}$ ), 4.51 (2H, s), 4.74 (1H, s), 7.05 (1H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.18–7.44 (9H, m), 8.33 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.43 (1H, d,  $J=5.4\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 430  $[M+H]^+$

実施例1119 (Ar: Pirazinyl;  $R^1$ : Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

10  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.09 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.92–2.03 (1H, m), 3.05 (2H, t,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.18 (1H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.46 (1H, dt,  $J=10.0\text{ Hz}$ ,  $8.3\text{ Hz}$ ), 3.78 (1H, dt,  $J=10.0\text{ Hz}$ ,  $8.3\text{ Hz}$ ), 4.90 (1H, s), 7.03 (1H, t,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.17–7.39 (5H, m), 7.42 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 8.32 (1H, t,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 8.44 (1H, s), 8.37 (1H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ ), 8.54 (1H, s)

ESI-MS ( $m/e$ ): 387  $[M+H]^+$

20 ジアステレオマーB

25  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.01 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.11 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.92–2.03 (1H, m), 3.02–3.13 (3H, m), 3.62 (1H, dt,  $J=10.0\text{ Hz}$ ,  $8.3\text{ Hz}$ ), 3.84 (1H, dt,  $J=10.0\text{ Hz}$ ,  $8.3\text{ Hz}$ ), 4.91 (1H, s), 7.03 (1H, t,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.17–7.39 (5H, m), 7.42 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 8.32 (1H, t,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 8.44 (1H, s), 8.47 (1H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ ), 9.01 (1H, s)

ESI-MS ( $m/e$ ): 387  $[M+H]^+$

実施例1120 (Ar: 2-Furyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.97 (3H, d, J=6.6Hz), 1.07  
 5 (3H, d, J=6.6Hz), 1.87-2.00 (1H, m), 3.04 (2  
 H, t, J=8.6Hz), 3.09 (1H, d, J=5.9Hz), 3.46  
 (1H, dt, J=9.5Hz, 8.6Hz), 3.77 (1H, dt, J=9.  
 5Hz, 8.6Hz), 4.79 (1H, s), 5.98 (1H, d, J=3.  
 2Hz), 6.34 (1H, s), 7.04 (1H, t, J=6.9Hz), 7.  
 10 18-7.48 (8H, m), 8.37 (1H, d, J=8.3Hz)

ESI-MS (m/e): 375 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.04 (3H, d, J=6.6Hz), 1.07  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.87-2.00 (1H, m), 3.11 (2  
 15 H, t, J=8.4Hz), 3.28 (1H, d, J=5.9Hz), 3.71  
 (1H, dt, J=8.8Hz, 8.2Hz), 3.91 (1H, dt, J=8.  
 8Hz, 8.2Hz), 4.82 (1H, s), 6.22 (2H, d, J=1.  
 8Hz), 7.04 (1H, t, J=6.9Hz), 7.18-7.48 (8H,  
 m), 8.32 (1H, d, J=8.3Hz)

20 ESI-MS (m/e): 375 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1124 (Ar: 2-Thienyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11  
 25 (3H, d, J=6.9Hz), 1.87-1.99 (1H, m), 3.03 (2  
 H, t, J=8.2Hz), 3.12 (1H, d, J=6.5Hz), 3.35  
 (1H, dt, J=9.7Hz, 8.5Hz), 3.73 (1H, dt, J=9.  
 7Hz, 8.5Hz), 5.04 (1H, s), 6.93 (1H, d, J=2.  
 1Hz), 7.06 (1H, t, J=7.6Hz), 7.13-7.36 (7H,

m), 7.42 (1H, d, J=6.9Hz), 7.49 (1H, d, J=6.9Hz), 8.36 (1H, d, J=8.3Hz)

ESI-MS (m/e) : 391 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- 5 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.05 (3H, d, J=6.9Hz), 1.11 (3H, d, J=6.9Hz), 1.87-1.99 (1H, m), 3.03 (2H, t, J=8.2Hz), 3.07 (1H, d, J=6.5Hz), 3.63 (1H, dt, J=9.7Hz, 8.5Hz), 3.87 (1H, dt, J=9.7Hz, 8.5Hz), 5.03 (1H, s), 6.87 (1H, d, J=2.1Hz), 6.91 (1H, t, J=7.6Hz), 7.13-7.36 (7H, m), 7.48 (2H, d, J=6.9Hz), 8.34 (1H, d, J=8.3Hz)
- 10

ESI-MS (m/e) : 391 [M+H]<sup>+</sup>

- 実施例1128 (Ar: 2-Thiazolyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)
- 15

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.05 (3H, d, J=7.0Hz), 1.10 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91-2.01 (1H, m), 2.99-3.19 (3H, m), 3.73 (1H, dt, J=10.0Hz, 8.7Hz), 3.80-3.97 (1H, m), 5.18 (1H, s), 7.04 (1H, t, J=7.4Hz), 7.16-7.37 (6H, m), 7.44 (1H, d, J=7.2Hz), 7.50 (1H, d, 6.7Hz), 7.66-7.68 (1H, m), 8.34 (1H, d, J=7.9Hz)
- 20

ESI-MS (m/e) : 392 [M+H]<sup>+</sup>

- 25 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.99 (3H, d, J=7.0Hz), 1.08 (3H, d, J=6.6Hz), 1.91-2.01 (1H, m), 2.99-3.19 (3H, m), 3.34 (1H, dt, J=10.0Hz, 8.7Hz), 3.80-3.97 (1H, m), 5.11 (1H, s), 7.04 (1H, t,

$J=7.4\text{ Hz}$ ),  $7.16-7.37$  (6H, m),  $7.44$  (1H, d,  $J=7.2\text{ Hz}$ ),  $7.50$  (1H, d,  $6.7\text{ Hz}$ ),  $7.66-7.68$  (1H, m),  $8.31$  (1H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS (m/e) : 392 [M+H]<sup>+</sup>

- 5 実施例1130 (Ar: 5-Thiazolyl; R<sup>1</sup>: Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.02 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.88-2.00 (1H, m), 3.03 (2  
10 H, t,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.28 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.28-3.36 (1H, m), 3.65-4.00 (1H, m), 5.11 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.17-7.48 (7H, m), 7.75 (1H, s), 8.35 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.76 (s, 1H)

- 15 ESI-MS (m/e) : 392 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.07 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.88-2.00 (1H, m), 3.03 (2  
20 H, t,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.28 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.65-3.77 (1H, m), 3.79-4.00 (1H, m), 5.07 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.17-7.48 (7H, m), 7.75 (1H, s), 8.33 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.65 (s, 1H)

ESI-MS (m/e) : 392 [M+H]<sup>+</sup>

- 25 実施例1181 (Ar: 4-Pyridyl; R<sup>1</sup>: 4-F-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.03 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.11 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.89-2.06 (1H, m), 3.06-

3. 14 (3H, m), 3. 46 (1H, dt, J=8. 6Hz, 8. 6Hz),  
 3. 81 (1H, dt, J=10. 0Hz, 8. 6Hz), 4. 72 (1H, s),  
 7. 01-7. 10 (3H, m), 7. 21-7. 34 (2H, m), 7. 34  
 (2H, d, J=3. 4Hz), 7. 40-7. 45 (2H, m), 8. 35 (1  
 5 H, d, J=7. 9Hz), 8. 51 (2H, d, J=3. 4Hz)

ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 07 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 11  
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 93-2. 06 (1H, m), 3. 06-  
 10 3. 14 (3H, m), 3. 52 (1H, dt, J=9. 0Hz, 8. 1Hz),  
 3. 85 (1H, dt, J=9. 0Hz, 9. 0Hz), 4. 69 (1H, s),  
 6. 97 (2H, t, J=7. 6Hz), 7. 08 (1H, t, J=7. 6Hz),  
 7. 20-7. 36 (4H, m), 7. 43 (2H, d, J=3. 8Hz), 8.  
 36 (1H, d, J=8. 3Hz), 8. 56 (2H, d, J=3. 8Hz)

15 ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1182 (Ar: 4-Pyridyl; R<sup>1</sup>: 4-HOCH<sub>2</sub>-Ph;  
 R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroind  
 o1yl)

ジアステレオマーA

20 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 00 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 1  
 0 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 85-1. 95 (1H, m), 3. 01  
 -3. 13 (3H, m), 3. 42 (1H, dt, J=8. 8Hz, 8. 8Hz),  
 3. 70-3. 87 (1H, m), 4. 59 (1H, s), 4. 68-4. 69  
 (2H, m), 7. 05 (1H, t, J=7. 5Hz), 7. 18-7. 40 (6  
 25 H, m), 8. 32 (1H, dd, J=7. 9Hz, 4. 0Hz), 8. 41 (1  
 H, d, J=5. 9Hz), 8. 51 (1H, d, J=5. 9Hz)

ESI-MS (m/e) : 416 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1. 16 (3H, d, J=7. 0Hz), 1. 1

0 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.85–1.95 (1H, m), 3.01–3.13 (3H, m), 3.50 (1H, dt,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $8.7\text{ Hz}$ ), 3.70–3.87 (1H, m), 4.59 (1H, s), 4.68–4.69 (2H, m), 7.05 (1H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 7.18–7.40 (6  
 5 H, m), 8.32 (1H, dd,  $J=7.9\text{ Hz}$ ,  $4.0\text{ Hz}$ ), 8.41 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 8.51 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 416  $[M+H]^+$

実施例1183 (Ar: 4-Pyridyl;  $R^1$ : 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph;  
 $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroind  
 10 olyl)

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.89–1.97 (1H, m), 3.04–3.11 (3H, m), 3.33 (3H, s), 3.33–3.52 (1H,  
 15 m), 3.71–3.84 (1H, m), 4.38 (2H, s), 4.69 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.18–7.43 (8H, m), 8.34 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.47 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 8.54 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 430  $[M+H]^+$

20 ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.04 (3H, d,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.89–1.97 (1H, m), 3.04–3.11 (3H, m), 3.42 (3H, s), 3.33–3.52 (1H,  
 25 m), 3.71–3.84 (1H, m), 4.42 (2H, s), 4.71 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.18–7.43 (8H, m), 8.34 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.47 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 8.54 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 430  $[M+H]^+$

実施例1199 (Ar: 3-F-4-Pyridyl;  $R^1$ : 4-MeOC

H<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.9Hz), 1.10  
 5 (3H, d, J=6.9Hz), 1.93 (1H, qd, J=6.9Hz, 6.9Hz), 3.12 (1H, d, J=6.9Hz), 3.38 (1H, td, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.42 (3H, s), 3.75 (1H, td, J=8.8Hz, 8.8Hz), 4.43 (2H, s), 4.75 (1H, s), 7.02 (1H, s), 7.08 (1H, d, J=7.1Hz), 7.18-7.  
 10 24 (1H, m), 7.31 (2H, d, J=8.3Hz), 7.40 (2H, d, J=7.8Hz), 8.07 (1H, d, J=4.7Hz), 8.33 (1H, d, J=8.2Hz)

ESI-MS (m/e): 448 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

15 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.07 (3H, d, J=6.6Hz), 1.09 (3H, d, J=6.6Hz), 1.97 (1H, qd, J=6.6Hz, 6.6Hz), 3.10 (2H, t, J=8.9Hz), 3.12 (1H, d, J=6.6Hz), 3.33 (3H, s), 3.57 (1H, td, J=8.9Hz, 8.9Hz), 3.88 (1H, td, J=8.9Hz, 8.9Hz), 4.3  
 20 8 (2H, s), 4.72 (1H, s), 7.06-7.33 (9H, m), 8.14 (1H, d, J=5.4Hz), 8.32 (1H, d, J=8.5Hz)

ESI-MS (m/e): 448 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1202 (Ar:3-F-4-Pyridyl; R<sup>1</sup>:4-MeSO<sub>2</sub>(Me)NCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)  
 25

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.01 (3H, d, J=6.5Hz), 1.09 (3H, d, J=7.0Hz), 1.89-2.00 (1H, m), 2.77 (3H, s), 2.87 (3H, s), 3.05 (2H, t, J=8.2Hz), 3.

0.9 (1H, d,  $J=6.6$  Hz), 3.37 (1H, dt,  $J=9.8$  Hz, 8.6 Hz), 3.76 (1H, dt,  $J=9.8$  Hz, 8.6 Hz), 4.29 (2H, s), 4.75 (1H, s), 7.02 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.6$  Hz), 7.19–7.26 (3H, m), 7.32 (2H, d,  $J=7.9$  Hz), 7.41 (2H, d,  $J=7.9$  Hz), 8.08 (1H, d,  $J=4.8$  Hz), 8.32 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 525  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.07 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.09 (3H, d,  $J=6.7$  Hz), 1.90–2.02 (1H, m), 2.69 (3H, s), 2.81 (3H, s), 3.07–3.13 (3H, m), 3.59 (1H, dt,  $J=8.6$  Hz, 8.5 Hz), 3.88 (1H, dt,  $J=8.6$  Hz, 8.5 Hz), 4.23 (2H, s), 4.70 (1H, s), 7.06 (1H, t,  $J=7.4$  Hz), 7.12 (1H, s), 7.19–7.35 (7H, m), 8.15 (1H, d,  $J=5.3$  Hz), 8.31 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 525  $[M+H]^+$

実施例1248 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4-F-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ )W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.01 (3H, d,  $J=7.1$  Hz), 1.09 (3H, d,  $J=6.6$  Hz), 1.88–1.95 (1H, m), 3.03–3.11 (3H, m), 3.45 (1H, dt,  $J=8.6$  Hz, 8.6 Hz), 3.79 (1H, dt,  $J=9.0$  Hz, 9.0 Hz), 4.70 (1H, s), 6.90–7.44 (11H, m), 8.35 (1H, d,  $J=8.3$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 421  $[M+H]^+$

実施例1249 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4-HOCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ )W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA



<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=7.0 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.88-1.95 (1H, m), 3.05 (2H, t, J=8.4 Hz), 3.11 (1H, d, J=6.9 Hz), 3.46 (1H, dt, J=8.4 Hz, 8.4 Hz), 3.73-3.83 (1H, m),  
 5 4.59 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.89-7.07 (3H, m), 7.18-7.46 (8H, m), 8.34 (1H, dd, J=8.0 Hz, 3.6 Hz)

ESI-MS (m/e): 433 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

10 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=7.0 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.88-1.95 (1H, m), 3.05 (2H, t, J=8.4 Hz), 3.13 (1H, d, J=7.0 Hz), 3.46 (1H, dt, J=8.4 Hz, 8.4 Hz), 3.73-3.83 (1H, m),  
 15 4.68 (2H, s), 4.72 (1H, s), 6.89-7.07 (3H, m), 7.18-7.46 (8H, m), 8.34 (1H, dd, J=8.0 Hz, 3.6 Hz)

ESI-MS (m/e): 433 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1250 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl

20 1)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.91 (1H, qd, J=6.7 Hz, 6.7 Hz), 3.03 (2H, t, J=8.6 Hz), 3.14 (1H, d, J=6.7 Hz), 3.42 (3H, s), 3.47 (1H, td, J=8.6 Hz, 8.6 Hz), 3.75 (1H, td, J=8.6 Hz, 8.6 Hz), 4.42 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.92 (2H, t, J=8.7 Hz), 7.05 (1H, t, J=6.9 Hz), 7.17-7.36 (6H, m), 7.44 (2H, d, J=7.8 Hz), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 447 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.5Hz), 1.10  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.87-1.97 (1H, m), 3.05 (2  
 5 H, t, J=8.8Hz), 3.12 (1H, d, J=6.2Hz), 3.32  
 (3H, s), 3.46 (1H, td, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.7  
 9 (1H, td, J=8.8Hz, 8.8Hz), 4.37 (2H, s), 4.  
 73 (1H, s), 6.97-7.07 (3H, m), 7.18-7.23 (4  
 H, m), 7.34 (2H, d, J=8.3Hz), 7.44 (2H, t, J=  
 10 6.0Hz), 8.35 (1H, d, J=8.3Hz)

ESI-MS (m/e) : 447 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1251 (Ar : 4-F-Ph; R<sup>1</sup> : 4-MeSO<sub>2</sub> (Me) NCH  
<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup> : H; R<sup>3</sup> : i-Pr; R<sup>4</sup> : H; N(R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup> : Dihydr  
 oindolyl)

15 ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.92 (1H, qd, J=6.6Hz, 6.  
 6Hz), 2.76 (3H, s), 2.85 (3H, s), 3.04 (2H, t,  
 J=8.8Hz), 3.12 (1H, d, J=6.6Hz), 3.42 (1H,  
 20 td, J=8.8Hz, 8.8Hz), 3.78 (1H, dt, J=8.8Hz,  
 8.8Hz), 4.28 (2H, s), 4.72 (1H, s), 6.93 (2H,  
 t, J=8.4Hz), 7.05 (1H, t, J=7.2Hz), 7.18-7.  
 36 (6H, m), 7.45 (2H, d, J=8.3Hz), 8.34 (1H,  
 d, J=8.2Hz)

25 ESI-MS (m/e) : 524 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.01 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10  
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.92 (1H, qd, J=6.6Hz, 6.  
 6Hz), 2.70 (3H, s), 2.79 (3H, s), 3.06 (2H, t,

J=8.8 Hz), 3.11 (1H, d, J=6.6 Hz), 3.47 (1H, td, J=8.8 Hz, 8.8 Hz), 3.80 (1H, dt, J=8.8 Hz, 8.8 Hz), 4.22 (2H, s), 4.72 (1H, s), 7.01 (2H, t, J=8.5 Hz), 7.06 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.18-7.21 (3H, m), 7.36 (3H, d, J=7.8 Hz), 7.44 (2H, dd, J=8.37 Hz, 5.41 Hz), 8.34 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 524 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1252 (Ar:4-F-Ph; R<sup>1</sup>:4-MeSO<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-Ph;  
10 R<sup>2</sup>:H; R<sup>3</sup>:i-Pr; R<sup>4</sup>:H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>:Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.92 (1H, qd, J=6.7 Hz, 6.7 Hz), 2.90 (3H, s), 3.05 (2H, t, J=8.7 Hz), 3.11 (1H, d, J=6.7 Hz), 3.45 (1H, td, J=8.7 Hz, 8.7 Hz), 3.78 (1H, td, J=8.7 Hz, 8.7 Hz), 4.30 (2H, d, J=6.3 Hz), 4.68-4.71 (1H, brs), 4.71 (s, 1H), 6.90 (2H, t, J=8.4 Hz), 7.05 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.18-7.35 (6H, m), 7.46 (2H, d, J=8.3 Hz), 8.34 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 510 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.92 (1H, qd, J=6.7 Hz, 6.7 Hz), 2.84 (3H, s), 3.06 (2H, t, J=8.8 Hz), 3.10 (1H, d, J=6.7 Hz), 3.46 (1H, td, J=8.8 Hz, 8.8 Hz), 3.80 (1H, td, J=8.8 Hz, 8.8 Hz), 4.23 (2H, d, J=5.9 Hz), 4.47-4.50 (1H, brs), 4.

7.2 (s, 1H), 6.97–7.08 (3H, m), 7.18–7.23 (4H, m), 7.36 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.42 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $5.7$  Hz), 8.32 (1H, d,  $J=7.9$  Hz)

ESI-MS ( $m/e$ ): 510  $[M+H]^+$

- 5 実施例1253 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4- $H_2NCH_2$ -Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ )W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

- $^1H$ NMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=5.9$  Hz), 1.10 (3H, d,  $J=6.9$  Hz), 1.86–1.97 (1H, m), 3.04 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 3.11 (1H, d,  $J=5.9$  Hz), 3.45 (1H, td,  $J=8.6$  Hz,  $8.6$  Hz), 3.72–3.81 (1H, m), 3.77 (2H, s), 4.70 (1H, s), 6.89–7.07 (3H, m), 7.17–7.64 (8H, m), 8.35 (1H, dd,  $J=7.9$  Hz, 2.4 Hz)
- 15

ESI-MS ( $m/e$ ): 432  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

- $^1H$ NMR ( $CDCl_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=5.9$  Hz), 1.10 (3H, d,  $J=6.9$  Hz), 1.86–1.97 (1H, m), 3.05 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 3.14 (1H, d,  $J=6.3$  Hz), 3.51 (1H, td,  $J=8.6$  Hz,  $8.6$  Hz), 3.72–3.81 (1H, m), 3.85 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.89–7.07 (3H, m), 7.17–7.64 (8H, m), 8.35 (1H, dd,  $J=7.9$  Hz, 2.4 Hz)
- 20

- 25 ESI-MS ( $m/e$ ): 432  $[M+H]^+$

実施例1254 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4-MeNHCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : *i*-Pr;  $R^4$ : H; N( $R^5$ )W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.99 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.11 (3H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 1.90 (1H, qd,  $J=6.5\text{ Hz}$ , 6.5 Hz), 2.46 (3H, s), 3.03 (2H, t,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.14 (1H, d,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 3.42 (1H, td,  $J=8.8\text{ Hz}$ , 8.8 Hz), 3.73 (2H, s), 3.75 (1H, dt,  $J=8.8\text{ Hz}$ , 8.8 Hz), 4.71 (1H, s), 6.92 (2H, t,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.05 (1H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.18–7.28 (4H, m), 7.35 (2H, dd,  $J=8.4\text{ Hz}$ , 5.6 Hz), 7.41 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )

10 ESI-MS ( $m/e$ ): 446  $[\text{M}+\text{H}]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.00 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.84–1.95 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.05 (2H, t,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.10 (1H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.46 (1H, td,  $J=8.8\text{ Hz}$ , 8.8 Hz), 3.67 (2H, s), 3.79 (1H, dt,  $J=8.8\text{ Hz}$ , 8.8 Hz), 4.71 (1H, s), 7.00 (2H, t,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.06 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.21 (4H, dd,  $J=12.8\text{ Hz}$ , 4.9 Hz), 7.32 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.44 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ , 5.6 Hz), 8.35 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )

20 ESI-MS ( $m/e$ ): 446  $[\text{M}+\text{H}]^+$

実施例1255 (Ar: 4-F-Ph;  $\text{R}^1$ : 4-Me<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>-Ph;  $\text{R}^2$ : H;  $\text{R}^3$ : i-Pr;  $\text{R}^4$ : H; N( $\text{R}^5$ )W- $\text{R}^6$ : Dihydroindolyl)

25 ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.98 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.11 (3H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.90 (1H, qd,  $J=6.8\text{ Hz}$ , 6.8 Hz), 2.24 (6H, s), 3.01 (2H, t,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 3.14 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.39 (2H, s), 3.32–3.4

4 (1H, m), 3.73 (1H, dt, J=8.7 Hz, 8.7 Hz), 4.71 (1H, s), 6.92 (2H, t, J=8.8 Hz), 7.04 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.16-7.25 (4H, m), 7.33-7.41 (4H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

5 ESI-MS (m/e) : 460 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.91 (1H, qd, J=6.5 Hz, 6.5 Hz), 2.19 (6H, s), 3.05 (2H, t, J=8.9 Hz), 3.11 (1H, d, J=6.5 Hz), 3.34 (2H, s), 3.46 (1H, dt, J=8.9 Hz, 8.9 Hz), 3.79 (1H, dt, J=8.9 Hz, 8.9 Hz), 4.71 (1H, s), 6.97-7.07 (3H, m), 7.18 (3H, d, J=7.9 Hz), 7.24 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.30 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.44 (2H, dd, J=8.5 Hz, 5.6 Hz), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

10 15

ESI-MS (m/e) : 460 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1274 (Ar : 4-F-Ph; R<sup>1</sup> : 4-MeOCOCH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup> : H; R<sup>3</sup> : i-Pr; R<sup>4</sup> : H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup> : Dihydroindolyl)

20 ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.91 (1H, qd, J=6.7 Hz, 6.7 Hz), 3.04 (2H, t, J=8.3 Hz), 3.14 (1H, d, J=6.7 Hz), 3.43 (2H, s), 3.44 (1H, td, J=8.3 Hz, 8.3 Hz), 3.73 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.73-3.81 (1H, m), 4.70 (1H, s), 6.92 (2H, t, J=8.7 Hz), 7.35 (1H, t, J=6.9 Hz), 7.17-7.37 (6H, m), 7.41 (2H, d, J=8.3 Hz), 8.35 (1H, d, J=8.2 Hz)

25

ESI-MS (m/e) : 504 [M+H]<sup>+</sup>

## ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.00 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.92 (1H, qd, J=6.6 Hz, 6.6 Hz), 3.05 (2H, t, J=8.9 Hz), 3.10 (3H, s), 3.11 (1H, d, J=6.6 Hz), 3.43 (1H, td, J=8.9 Hz, 8.9 Hz), 3.72 (3H, s), 3.78 (1H, td, J=8.9 Hz, 8.9 Hz), 3.95 (2H, s), 4.45 (2H, s), 4.71 (1H, s), 6.93 (2H, t, J=8.8 Hz), 7.05 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.18-7.36 (6H, m), 7.44 (2H, d, J=8.3 Hz), 8.34 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e): 582 [M+H]<sup>+</sup>

実施例1275 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeOCOCH<sub>2</sub> (Me)NCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>: H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; N(R<sup>5</sup>)W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

## 15 ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.99 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.11 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.91 (1H, qd, J=6.7 Hz, 6.7 Hz), 2.37 (3H, s), 3.01 (2H, t, J=8.8 Hz), 3.13 (1H, d, J=6.7 Hz), 3.26 (2H, s), 3.39 (1H, td, J=8.8 Hz, 8.8 Hz), 3.64 (2H, s), 3.71 (3H, s), 3.67-3.79 (1H, m), 4.71 (1H, s), 6.92 (2H, t, J=8.7 Hz), 7.05 (1H, t, J=7.4 Hz), 7.17-7.41 (8H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e): 518 [M+H]<sup>+</sup>

## 25 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.93-1.01 (9H, m), 1.10 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.61-1.75 (2H, m), 1.91 (1H, qd, J=6.5 Hz, 6.5 Hz), 2.19 (2H, t, J=7.4 Hz), 3.04 (2H, t, J=8.8 Hz), 3.12 (1H, d, J=6.5 Hz),

3. 44 (1H, td,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $8.8\text{ Hz}$ ), 3. 77 (1H, td,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $8.8\text{ Hz}$ ), 4. 43 (2H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 4. 70 (1H, s), 5. 71 (1H, brs), 6. 92 (1H, t,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7. 05 (1H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7. 18–7. 42 (8H, m), 8. 34 (1H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 502  $[M+H]^+$

実施例1276 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4-MeO<sub>2</sub>CCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

10 <sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1. 00 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 09 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 91–1. 94 (1H, m), 3. 00–3. 16 (3H, m), 3. 37–3. 34 (1H, m), 3. 54 (2H, s), 3. 65 (3H, s), 3. 71–3. 81 (1H, m) 4. 71 (1H, s), 6. 89–7. 47 (11H, m), 8. 35 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )

15 ESI-MS ( $m/e$ ): 475  $[M+H]^+$

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1. 00 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 10 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 91–1. 94 (1H, m), 3. 00–3. 16 (3H, m), 3. 37–3. 34 (1H, m), 3. 60 (2H, s), 20 3. 70 (3H, s), 3. 71–3. 81 (1H, m) 4. 71 (1H, s), 6. 89–7. 47 (11H, m), 8. 35 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )

ESI-MS ( $m/e$ ): 475  $[M+H]^+$

実施例1277 (Ar: 4-F-Ph;  $R^1$ : 4-HO<sub>2</sub>CCH<sub>2</sub>-Ph;  $R^2$ : H;  $R^3$ : i-Pr;  $R^4$ : H; ( $R^5$ ) W- $R^6$ : Dihydroindolyl)

25 ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1. 00 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 09 (3H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1. 95–2. 05 (1H, m), 2. 98–3. 18 (3H, m), 3. 35–3. 43 (1H, m), 3. 55 (2H, s), 3. 70–3. 80 (1H, m) 4. 74 (1H, s), 6. 88–7. 47 (1



1H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 461 [M+H]<sup>+</sup>

ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10  
5 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.95-2.05 (1H, m), 2.98-  
3.18 (3H, m), 3.32-3.43 (1H, m), 3.61 (2H, s),  
3.70-3.80 (1H, m) 4.74 (1H, s), 6.88-7.47 (1  
1H, m), 8.35 (1H, d, J=7.9 Hz)

ESI-MS (m/e) : 461 [M+H]<sup>+</sup>

10 実施例1278 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: 4-NCCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>: H;  
R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; (R<sup>5</sup>) W-R<sup>6</sup>: Dihydroindolyl)

ジアステレオマーA

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.01 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.09  
(3H, d, J=6.7 Hz), 1.91-1.94 (1H, m), 3.04-  
15 3.12 (3H, m), 3.45-3.49 (1H, m), 3.66 (2H, s),  
3.78-3.83 (1H, m) 4.72 (1H, s), 6.91-6.98 (3  
H, m), 7.01-7.50 (8H, m), 8.36 (1H, d, J=7.9  
Hz)

ESI-MS (m/e) : 442 [M+H]<sup>+</sup>

20 ジアステレオマーB

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.02 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10  
(3H, d, J=6.7 Hz), 1.91-1.94 (1H, m), 3.04-  
3.12 (3H, m), 3.45-3.49 (1H, m), 3.72 (2H, s),  
3.78-3.83 (1H, m) 4.73 (1H, s), 6.91-6.98 (3  
25 H, m), 7.01-7.50 (8H, m), 8.36 (1H, d, J=7.9  
Hz)

ESI-MS (m/e) : 442 [M+H]<sup>+</sup>

実施例2117 (Ar: 4-F-Ph; R<sup>1</sup>: 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph; R<sup>2</sup>:  
H; R<sup>3</sup>: i-Pr; R<sup>4</sup>: H; R<sup>5</sup>: Me; R<sup>6</sup>: 2-Thiazolyl; W:

単結合)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.02 (3H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 1.04 (3H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 1.88–1.99 (1H, m), 2.50 (1H, br), 2.91 (3H, s), 3.42 (3H, s), 3.49 (1H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ ), 4.29 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 4.58 (1H, m), 4.61 (1H, s), 6.93 (2H, t,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.04 (1H, d,  $J=3.7\text{ Hz}$ ), 7.31 (4H, t,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.43 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=3.7\text{ Hz}$ )  
ESI-MS ( $m/e$ ): 505  $[\text{M}+\text{H}]^+$

10 実施例2118 (Ar: 4-F-Ph;  $\text{R}^1$ : 4-MeSO<sub>2</sub>HNCH<sub>2</sub>-Ph;  $\text{R}^2$ : H;  $\text{R}^3$ : i-Pr;  $\text{R}^4$ : H;  $\text{R}^5$ : Me;  $\text{R}^6$ : 2-Thiazolyl; W: 単結合)

ジアステレオマーA

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.01 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.05 (3H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 1.90–2.01 (1H, m), 2.76 (3H, s), 2.85 (3H, s), 3.41 (3H, s), 3.50 (1H, d,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 4.28 (2H, s), 4.62 (1H, s), 6.94 (2H, t,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.04 (1H, d,  $J=3.7\text{ Hz}$ ), 7.28–7.37 (4H, m), 7.42 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=3.7\text{ Hz}$ )  
ESI-MS ( $m/e$ ): 519  $[\text{M}+\text{H}]^+$

ジアステレオマーB

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.01 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.05 (3H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.89–2.01 (1H, m), 2.71 (3H, s), 2.81 (3H, s), 3.44 (3H, s), 3.49 (1H, d,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 4.23 (2H, s), 4.61 (1H, s), 7.01 (2H, t,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.04 (1H, d,  $J=3.6\text{ Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.35 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.40 (2H, dd,  $J=8.4\text{ Hz}$ ,  $7.8\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=$

3. 6 Hz)

ESI-MS (m/e) : 519 [M+H]<sup>+</sup>

実施例 2120 (Ar : 4-F-Ph ; R<sup>1</sup> : 4-MeOCOCH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-Ph ; R<sup>2</sup> : H ; R<sup>3</sup> : i-Pr ; R<sup>4</sup> : H ; R<sup>5</sup> : Me ; R<sup>6</sup> : 2-Thiaz  
5 olyl ; W : 単結合)

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>) δ : 1.00 (3H, d, J=6.9 Hz), 1.05  
(3H, d, J=6.6 Hz), 1.88-1.99 (1H, m), 3.42 (3  
H, s), 3.43 (2H, s), 3.52 (1H, d, J=5.5 Hz), 3.  
72 (3H, s), 3.77 (2H, s), 4.60 (1H, s), 6.93 (2  
10 H, t, 8.6 Hz), 7.04 (1H, d, J=4.0 Hz), 7.28 (2  
H, d, J=7.9 Hz), 7.32 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.34  
(1H, d, J=8.6 Hz), 7.37 (2H, d, J=7.9 Hz), 7.  
53 (1H, d, J=4.0 Hz)

ESI-MS (m/e) : 499 [M+H]<sup>+</sup>

15 (製剤化例)

以下に本発明の化合物の製剤化例を示すが、本発明の化合物の製剤化は、本製  
剤化例に限定されるものではない。

製剤化例 1

実施例 1274 の化合物 45 (部)

20 重質酸化マグネシウム 15

乳糖 75

を均一に混合して 350 μm 以下の粉末状又は細粒状の散剤とする。この散剤を  
カプセル容器に入れてカプセル剤とした。

製剤化例 2

25 実施例 2100 の化合物 45 (部)

澱粉 15

乳糖 16

結晶性セルロース 21

ポリビニルアルコール 3

蒸留水 3 0

を均一に混合した後、破碎造粒して乾燥し、次いで篩別して 1 4 1 ~ 1 7 7  $\mu$ m の大きさの顆粒剤とした。

製剤化例 3

- 5 製剤化例 2 と同様の方法で顆粒剤を作った後、この顆粒剤 9 6 部に対してステアリン酸カルシウム 4 部を加えて圧縮成形し、直径 1 0 mm の錠剤を作製した。

製剤化例 4

- 10 製剤化例 2 の方法で得られた顆粒剤の 9 0 部に対して結晶性セルロース 1 0 部及びステアリン酸カルシウム 3 部を加えて圧縮成形し、直径 8 mm の錠剤とした後、これにシロップゼラチン、沈降性炭酸カルシウム混合懸濁液を加えて糖衣錠を作製した。

### 産業上の利用可能性

- 15 本発明によれば、本発明化合物は、高い血中 GLP-1 濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病の治療、糖尿病の慢性合併症の予防又は肥満の治療等に有用である。



- アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より
- 15 選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、
- 20 ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^1$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル
- 25 基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアリールアミノ

- 基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、  
 N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファ  
 モイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N  
 - (N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカ  
 5 ノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノ  
 イルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキル  
 アミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アル  
 キルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$   
 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル  
 10 基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$   
 アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチ  
 オ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキル  
 スルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホ  
 ニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$   
 15  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-  
 ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N-  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアル  
 キルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換され  
 ていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、  
 20 分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$   
 アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換  
 基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族  
 基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリ  
 ジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェ  
 25 ニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル  
 基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チア  
 ジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリ  
 ミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル  
 基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニ

- ル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^2$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N$ -( $N$ -アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$



- $-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^3$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の
- 5
- 10
- 15
- 20
- 25

- 飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_10$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニ

- ル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、  
 ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリ  
 ノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノ  
 リル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、  
 5 エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソイ  
 ンドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニ  
 ル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベン  
 ゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリ  
 アゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より  
 10 選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原  
 子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^4$ は、  
 水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カ  
 ルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、  
 ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3$  -  
 15  $C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3$  -  $C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキ  
 ルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキル  
 カルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミ  
 ノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、  
 アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスル  
 20 ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、  
 アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1$  -  $C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、 $C_2$  -  $C_6$ アルカノイル基、N- $C_2$  -  $C_6$ アルカノイルアミノ基、N,  
 N-ジ- $C_2$  -  $C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1$  -  $C_6$ アルキルアミノ基、N,  
 N-ジ- $C_1$  -  $C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1$  -  $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、  
 25 N, N-ジ- $C_1$  -  $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2$  -  $C_6$ アルケニルカル  
 バモイル基、N, N-ジ- $C_2$  -  $C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1$  -  
 $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1$  -  $C_6$ アルコキシ $C_1$  -  $C_{10}$ アルキルカ  
 ルバモイル基、N- $C_1$  -  $C_6$ アルコキシカルボニル $C_1$  -  $C_{10}$ アルキルカルバモ  
 イル基、 $C_1$  -  $C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1$  -  $C_6$ アルキルスルファモイル基、N,

- N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基若しくはフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^5$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキ

- ルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N、N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスル
- 5 ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N、N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、
- 10 N、N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N、N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N、
- 15 N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN、
- 20 N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より
- 25 選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニ

- ル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、
- 5 キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^6$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カル
- 15 バモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール
- 20 基、 $N$ -アリールアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N$ -アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 $N$ -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N$ -( $N$ -アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N$ -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコ

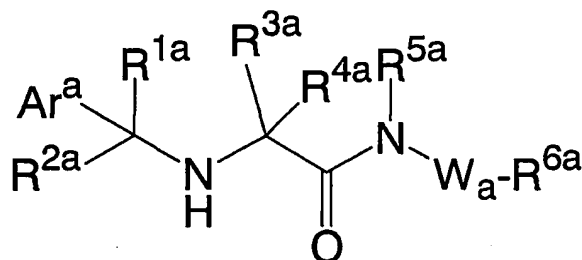
- キシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基を示すか、又は、 $R^6$ 及び $R^5$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族

- ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、
- 5 アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、
- 10 N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-（N-アロイルアミノ） $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル
- 15 基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、
- 20  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイ
- 25 ル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基



- 又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、Wは単結合又は直鎖状若しくは分枝鎖の $C_1-C_6$ 低級アルキレン基を示す]で表される化合物、その医薬上許容される塩若しくは
- 5 エステルを有効成分として含有することを特徴とする糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤。

(2) 一般式 (I-a)



- [式中、 $Ar^a$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シア
- 10 ノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリー
- ールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_1-C_6$
- 15  $C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルア
- ミノ基、N、N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアル
- 20 キルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるア
- 25 リール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、

- イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、
- 5 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1a}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラ
- 10 ルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボ
- 15 ニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪
- 20 族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、ア
- 25 ジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、

- テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2a}$ は、水素
- 5 原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2$
- 10  $-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ
- 15 基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換
- 20 されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、
- 25 ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群

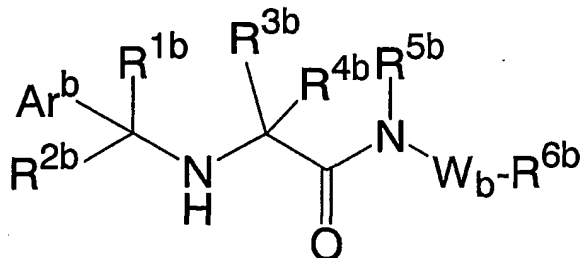
- より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3a}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4a}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、

- N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基及びC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R<sup>5a</sup>は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラキル基、アラキルオキシ基、アラキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基及びC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、

- インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり
- 5 1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6a}$ は、アミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラ
- 10 キル基、アラキルオキシ基、アラキルカルボニル基、アリール基、アリーロキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されてい
- 15 てもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イ
- 20 ソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、フリル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、
- 25 キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベンゾトリアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、 $R^{6a}$ 及び

$R^{5a}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、  
 ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される  
 脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、  
 シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキ  
 5 ルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-ア  
 リールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ  
 基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>アルコキシ基及びC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキ  
 ルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽  
 10 和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>  
 脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていても  
 よい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチ  
 エニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラ  
 15 ゴリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されて  
 いてもよい)を形成し、W<sub>b</sub>は単結合又は直鎖状のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>低級アルキレン基若  
 しくは分枝鎖のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>低級アルキレン基を示す]で表される化合物又はその医  
 薬上許容される塩若しくはエステルを有効成分として含有することを特徴とする  
 請求項1記載の糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤。

20 (3) 一般式 (I-b)



[式中、Ar<sup>b</sup>は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、  
 ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、N-C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 25 アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカル

- ポニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1b}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルア

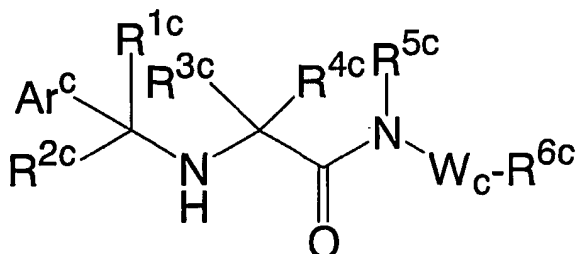


- ミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族
- 5 基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からな
- 10 る群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択さ
- 15 れるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3b}$ は、アミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる
- 20 群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及び
- 25 フリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳

- 香環基、 $R^{4b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボ
- 5 ニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群
- 10 より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択され
- 15 るヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5b}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族
- 20 基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、
- 25 酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基若しくはピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6b}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロ

- キシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに
- 5 に $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基及びピリジル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、ベンゾイミダゾリル基及びベンゾチアゾリル基
- 10 からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、又は、 $R^{5b}$ 及び $R^5$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1$
- 15  $-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、
- 20 ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい）を形成し、 $W_6$ は単結合を示す]で表される化合物又はその医薬上許容される塩若しくはエステルを有効成分として含有することを特徴とする請求項1記載の糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤。

## (4) 一般式 (I-c)



- [式中、Ar<sup>c</sup>は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイル基、N-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルカノイルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルカルバモイル基、N-アミノC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルファモイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルアミノ基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基、N-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基

- 及びN, N-ジ-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R<sup>1c</sup>は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N

- (N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカ  
 ノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノ  
 イルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキル  
 アミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アル  
 キルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$   
 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル  
 5 基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$   
 アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチ  
 オ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキル  
 10 スルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホ  
 ニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$   
 アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-  
 ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N-  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアル  
 キルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換され  
 15 ていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、  
 分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$   
 アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換  
 基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族  
 20 基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリ  
 ジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェ  
 ニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル  
 基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チア  
 ジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリ  
 25 ミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル  
 基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニ  
 ル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からな  
 る群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イ  
 ソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレン

- ジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2c}$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シク

- ロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N, N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1$
- 5  $-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるア
- 10 リール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニ
- 15 ル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、
- 20 フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ
- 25 基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラルキルアミノ基、 $N, N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N$ -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N$ -アリー



- ルアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホ  
 ニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリ  
 ールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバ  
 モイル基、アロイル基、アロキシ基、N- (N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ ア  
 5 ルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルア  
 ミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルア  
 ミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ ア  
 ルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N  
 10 -アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_1$   
 $_0$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキ  
 ルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモ  
 イル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルス  
 ルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニ  
 15 ルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C$   
 $_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基  
 及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ  
 れる置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族  
 20 基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の  
 不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ  
 基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキ  
 ル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソ  
 オキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾ  
 25 リル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジ  
 ニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニ  
 ル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、  
 ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリ  
 ノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノ

- リル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、  
 エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソイ  
 ンドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニ  
 ル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベ  
 ンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリ  
 アゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より  
 5 選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原  
 子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4c}$ は、  
 水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カ  
 ルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、  
 10 ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3$ -  
 $C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3$ - $C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキ  
 ルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキル  
 カルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミ  
 15 ノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、  
 アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスル  
 ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、  
 アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカル  
 バモイル基、 $C_2$ - $C_6$ アルカノイル基、N- $C_2$ - $C_6$ アルカノイルアミノ基、N,  
 20 N-ジ- $C_2$ - $C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、N,  
 N-ジ- $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、  
 N, N-ジ- $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2$ - $C_6$ アルケニルカル  
 バモイル基、N, N-ジ- $C_2$ - $C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1$ -  
 $C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカ  
 25 ルバモイル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル $C_1$ - $C_{10}$ アルキルカルバモ  
 イル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルファモイル基、N,  
 N-ジ- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、  
 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C$   
 $_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3$ - $C_6$ シクロア

- ルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基若しくはフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホ

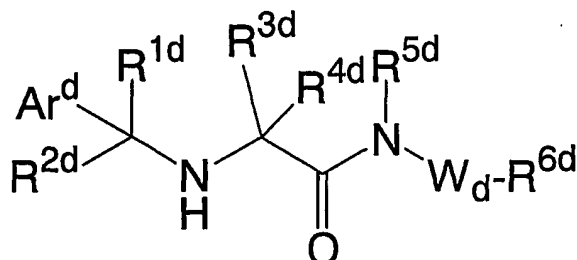
- ニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和  $C_3-C_9$ 脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、イ

- ンドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基
- 5 からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1
- 10 ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6c}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-ア
- 15 ラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバ
- 20 モイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ ア
- 25 ルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_10$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルス

- ルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニ  
 ルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-C$   
 $_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、  
 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基  
 5 及び $N$ 、 $N$ -ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択さ  
 れる置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽  
 和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$   
 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群よ  
 り選択される置換基で置換されていてもよい、イソオキサゾリル基、イソチアゾ  
 10 リル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、  
 チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピ  
 リダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フラザニル基、イミダ  
 ゾリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピ  
 ロリジニル基及びピロリニル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘ  
 15 テロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インド  
 リル基、エチレンジオキシフェニル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロイ  
 ンドリル基、チオナフテニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ナフチリジニ  
 ル基、フェナジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾ  
 チアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシ  
 20 フェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる  
 群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性  
 の複素芳香環基を示すか、又は、 $R^{5c}$ 及び $R^{5c}$ と結合する窒素原子と共に一緒にな  
 って、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及  
 びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族  
 25 ヘテロ環基は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、  
 カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、ニトロ  
 基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和  
 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N$ -アラル  
 キルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキ

- ルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- $C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、N-アミノ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル  $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和  $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、 $W_c$ は単結合を示す。但し  $Ar_c$ 、 $R^{1c}$ 及び $R^{2c}$ は同時にフェニル基である場合を除く]で表される化合物、その医薬上許容される塩若しくはエステル。

## (5) 一般式 (I-d)



- [式中、 $Ar^d$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N、N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されているもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されているもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又はイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1な



- いし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1d}$ は、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラ
- 5 ルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリーールオキシ基、アリーールスルホニル基、N-アリーールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボ
- 10 ニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖
- 15 の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選
- 20 択されるアリーール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリ
- 25 ル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2d}$ は、水素原子又はアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の

- 不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジ  
アラルキルアミノ基、アラルキルカルボニル基、アリールオキシ基、アリールス  
ルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2$   
- $C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$
- 5 アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、  
N- $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル $C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1-C$   
 $C_6$ アルキルチオ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコ  
キシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、N- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ  
基、N, N-ジ- $C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基及び $C_3-C_6$ シクロアルキル
- 10 オキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよ  
い、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽  
和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基  
並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換  
されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状
- 15 の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基  
及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及  
びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、  
ピリジニル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、  
ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員の
- 20 ヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル  
基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノ  
リニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフ  
ェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群  
より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の
- 25 複素芳香環基、 $R^{3d}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、  
ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状  
の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカ  
ルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリー  
ルスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N

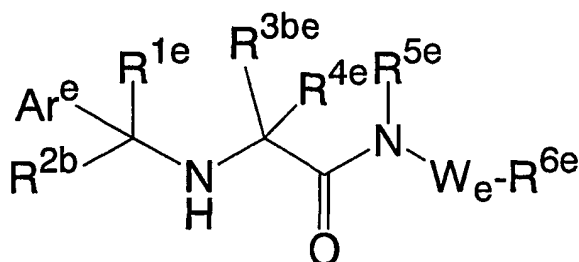
- $-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該
- 5 置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエ
- 10 ニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジ
- 15 オキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4d}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アラルキル
- 20 オキシ基、アラルキルカルボニル基アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N-アリールスルホニルアミノ基、アロイル基、アロキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$
- 25 アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-$

- C<sub>10</sub>アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R<sup>5d</sup>は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、N, N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基及びC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、直鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、分枝鎖の不飽和C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基並びにN-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、環状の不飽和C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>脂肪族基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロキノリニル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はアジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基から

- なる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6d}$ は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、テトラヒドロイソキノリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベンゾトリアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、 $R^{5d}$ 及び $R^{5d}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、アラルキル基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、アリールオキシ基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置

- 換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、 $W_d$ は単結合を示す。但し $Ar^d$ 、  
 5  $R^{1d}$ 及び $R^{2d}$ は同時にフェニル基である場合を除く]で表される請求項4記載の化合物又はその医薬上許容される塩若しくはエステル。

(6) 一般式 (I-e)



- [式中、 $Ar^e$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原子、  
 10 ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N, N$ -ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖  
 15 の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基又は  
 20 イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{1e}$ は、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、ハロゲン原  
 25 子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、 $N-C$

- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、
- 5 直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基
- 10 若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{2e}$ は、水素原子又はアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アリールスルホニル基、アロイル基、N- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N- $C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基及び $C_3-C_6$ シクロアルキルオキシ基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和
- 15  $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びにN- $C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基及びピペリジニル基
- 20 からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基が
- 25

- らなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{3e}$ は、アミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル
- 5 基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で
- 10 置換されていてもよい $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル
- 15 基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{4e}$ は、水素原子又はアミノ基、カルボキシ基、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、アリールオキシ基、 $C_2-C_6$ アルカノイル基、
- 20  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換され
- 25 ていてもよい、 $C_1-C_{10}$ アルキル基又はフェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはイソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基から



- なる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 $R^{5e}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基並びに直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基及びフリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基、イソインドリル基、インドリル基、ジヒドロイソインドリル基、ジヒドロインドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又はピロリジニル基及びピペリジニル基からなる群より選択される脂肪族ヘテロ環基からなる群より選択される置換を1ないし3個有していてもよい、飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基若しくは不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $R^{6e}$ は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、環状の飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3-C_9$ 脂肪族基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基チアゾリル基及びピリジル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基若しくはベンゾイミダゾリル基及びベンゾチアゾリル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択されるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は、 $R^{5e}$ 及び $R^{6e}$ と結合する窒素原子と共に一緒になって、ピロリジニル基、ピペリジニル基及びピペラジニル基からなる群から選択される脂肪族ヘテロ環基（但し、該脂肪族ヘテロ環基は、アミノ基、カルボキシ基、ハロゲン原子、ヒ

- ドロキシ基、アラルキル基、アロイル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基及び $C_1-C_6$ アルコシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和 $C_1-C_9$ 脂肪族基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基並びに $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい、フェニル基及びナフチル基からなる群より選択されるアリール基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基からなる群より選択される5員若しくは6員のヘテロ環基で縮合されていてもよい)を形成し、 $W_e$ は単結合を示す。但し $Ar^e$ 、 $R^{1e}$ 及び $R^{2e}$ は同時にフェニル基である場合を除く]で表される請求項4記載の化合物又はその医薬上許容される塩若しくはエステル。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/01810

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> A61K31/165, 31/167, 31/18, 31/341, 31/381, 31/4035, 31/405, 31/4168, 31/4184, 31/426, 31/427, 31/428, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/445, 31/4453, 31/451, 31/47,  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> A61K31/165, 31/167, 31/18, 31/341, 31/381, 31/4035, 31/405, 31/4168, 31/4184, 31/426, 31/427, 31/428, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/445, 31/4453, 31/451, 31/47,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 98/19998 A2 (Novartis AG), 14 May, 1998 (14.05.98), & EP 937040 A2 & JP 2000-511559 A	1-6
Y	WO 99/38501 A2 (Trustees of Tufts University), 05 August, 1999 (05.08.99), & EP 1052994 A2 & JP 2002-501889 A	1-6
Y	WO 98/35957 A1 (Bayer Corp.), 20 August, 1998 (20.08.98), & EP 910565 A1 & JP 2000-510164 A	1-6
Y	EP 945439 A1 (Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 29 September, 1999 (29.09.99), & WO 98/25908 A1 & US 6166038 A	1-6

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 06 June, 2002 (06.06.02)	Date of mailing of the international search report 25 June, 2002 (25.06.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/01810

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 955293 A1 (Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 10 November, 1999 (10.11.99), & WO 98/24768 A1 & US 6043246 A	1-6
<u>X</u> A	EP 528172 A1 (J. Uriach & Cia. S.A.), 24 February, 1993 (24.02.93), & JP 5-213879 A	<u>4-6</u> 1-3
<u>X</u> A	Database CAPLUS on STN, American Chemical Society (ACS), Columbus, OH, USA), DN.123:228825 & KUBOTA Hitoshi et al., Stereospecific Amination by Dynamic Kinetic Resolution Utilizing 2-Oxoimida- zolidine-4-carboxylate as a Novel Chiral Auxiliary, J. Organic Chemical, 1995, Vol.60, No.21, pages 6776 to 6784	<u>4-6</u> 1-3
P,A	JP 2001-131175 A (Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 15 May, 2001 (15.05.01), (Family: none)	1-6

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/01810

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:  
(See extra sheet)

1. ☒ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☒ No protest accompanied the payment of additional search fees.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/01810

## Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> 31/472, 31/495, 31/497, 31/5375, A61P3/04, 3/10, 43/00, C07C237/20, 311/05, 311/51, C07D209/08, 209/20, 211/16, 211/46, 211/58, 211/62, 213/38, 213/40, C07D213/42, 213/56, 213/61, 213/74, 213/75, 215/08, 217/06, 217/24, 233/88, 235/30, 277/82, 295/18, 307/52, 333/20, 401/12, 403/12, 405/12, 409/06, 409/12, 417/12, 471/04

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

## Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> 31/472, 31/495, 31/497, 31/5375, A61P3/04, 3/10, 43/00, C07C237/20, 311/05, 311/51, C07D209/08, 209/20, 211/16, 211/46, 211/58, 211/62, 213/38, 213/40, C07D213/42, 213/56, 213/61, 213/74, 213/75, 215/08, 217/06, 217/24, 233/88, 235/30, 277/82, 295/18, 307/52, 333/20, 401/12, 403/12, 405/12, 409/06, 409/12, 417/12, 471/04

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

## Continuation of Box No.II of continuation of first sheet(1)

Claims 1 to 3 pertain to a use of a compound represented by the general formula (I) given in claim 1, the general formula (I-a) given in claim 2, or the general formula (I-b) given in claim 3 as a diabetes remedy, preventive for diabetic chronic complications, or antiobestic agent based on the finding that a high in vivo blood GLP-1 concentration is attained with the compound.

In contrast, claims 4 to 6 pertain to a compound itself which is represented by the general formula (I-c) given in claim 4, (I-d) given in claim 5, or (I-e) given in claim 6. This compound is represented by none of the general formulae (I), (I-a), and (I-b).

From the statements given under Disclosure of the Invention in the description, it is considered that the subject matters disclosed in the claims include two inventive concepts, i.e., "a novel compound and a use thereof" and "a novel use of a known compound." Consequently, claims 1 to 3 and claims 4 to 6 are not considered to be a group of inventions so linked as to form a single general inventive concept.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> A61K31/165, 31/167, 31/18, 31/341, 31/381, 31/4035, 31/405, 31/4168, 31/4184, 31/426, 31/427, 31/428, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/445, 31/4453, 31/451, 31/47, 31/472, 31/495, 31/497, 31/5375, A61P3/04, 3/10, 43/00, C07C237/20, 311/05, 311/51, C07D209/08, 209/20, 211/16, 211/46, 211/58, 211/62, 213/38, 213/40

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> A61K31/165, 31/167, 31/18, 31/341, 31/381, 31/4035, 31/405, 31/4168, 31/4184, 31/426, 31/427, 31/428, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/445, 31/4453, 31/451, 31/47, 31/472, 31/495, 31/497, 31/5375, A61P3/04, 3/10, 43/00, C07C237/20, 311/05, 311/51, C07D209/08, 209/20, 211/16, 211/46, 211/58, 211/62, 213/38, 213/40

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 98/19998 A2 (NOVARTIS AG) 1998.05.14 & EP 937040 A2 & JP 2000-511559 A	1-6
Y	WO 99/38501 A2 (TRUSTEES OF TUFTS UNIVERSITY) 1999.08.05 & EP 1052994 A2 & JP 2002-501889 A	1-6

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

06.06.02

国際調査報告の発送日

25.06.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

森井 隆信



4C

9455

電話番号 03-3581-1101 内線 3451

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 98/35957 A1 (BAYER CORPORATION) 1998.08.20 & EP 910565 A1 & JP 2000-510164 A	1-6
Y	EP 945439 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 1999.09.29 & WO 98/25908 A1 & US 6166038 A	1-6
Y	EP 955293 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 1999.11.10 & WO 98/24768 A1 & US 6043246 A	1-6
<u>X</u> A	EP 528172 A1 (J. URIACH & CIA. S.A.) 1993.02.24 & JP 5-213879 A	<u>4-6</u> 1-3
<u>X</u> A	Database CAPLUS on STN, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY (ACS), Columbus, OH, USA), DN. 123:228825 & KUBOTA Hitoshi et al, Stereospecific Amination by Dynamic Kinetic Resolution Utilizing 2-Oxoimidazolidine-4- carboxylate as a Novel Chiral Auxiliary, J. Organic Chemical, 1995, Vol.60, No.21, pages 6776 to 6784	<u>4-6</u> 1-3
PA	JP 2001-131175 A (萬有製薬株式会社) 2001.05.15 (ファミリーなし)	1-6



## 第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

(特別ページ参照。)

1. ☒ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☒ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

## 第1ページの続葉(1) 第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 の続き

請求の範囲1乃至3記載の発明は、請求の範囲1における一般式(I)、請求の範囲2における一般式(I-a)又は請求の範囲3における一般式(I-b)の化合物が生体内において高い血中GLP-1濃度を達成することを見出したことに基づく、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤という用途を提供することに関するものである。

これに対し、請求の範囲4乃至6記載の発明は、上記一般式(I)、(I-a)、(I-b)のいずれでもなく、請求の範囲4における一般式(I-c)、請求の範囲5における(I-d)又は請求の範囲6における(I-e)で表される化合物自体を提供することに関するものである。

本願明細書における発明の開示の記載からしても、本願の請求の範囲に記載された発明には、「新規化合物の発明とその用途発明」と「公知化合物の新規用途発明」という2つの発明概念が混在しているものと認められ、その結果、請求の範囲1乃至3記載の発明と、請求の範囲4乃至6記載の発明は、単一の一般的発明概念を形成するように連関している一群の発明には当たらないこととなる。

## 第2ページ A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) の続き

Int. Cl<sup>7</sup> C07D213/42, 213/56, 213/61, 213/74, 213/75, 215/08, 217/06, 217/24, 233/88, 235/30, 277/82, 295/18, 307/52, 333/20, 401/12, 403/12, 405/12, 409/06, 409/12, 417/12, 471/04

## 第2ページ B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC)) の続き

Int. Cl<sup>7</sup> C07D213/42, 213/56, 213/61, 213/74, 213/75, 215/08, 217/06, 217/24, 233/88, 235/30, 277/82, 295/18, 307/52, 333/20, 401/12, 403/12, 405/12, 409/06, 409/12, 417/12, 471/04

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**